This Page Is Inserted by IFW Operations and is not a part of the Official Record

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning documents will not correct images, please do not report the images to the Image Problems Mailbox.



- 19 BUNDESREPUBLIK **DEUTSCHLAND**
- Offenlegungsschrift
- [®] DE 196 23 744 A 1



DEUTSCHES PATENTAMT

- Aktenzeichen: 196 23 744.0 Anmeldetag: 14. 6.98
 - Offenlegungstag: 18. 12. 97

(5) Int. Cl.6: C 07 C 233/53 C 07 C 229/62 C 07 C 233/57 C 07 C 233/64

C 07 C 235/76 C 07 C 237/30 C 07 C 251/24 C 07 C 251/48 C 07 C 275/42 A 01 N 37/22 A 01 N 33/08 A 01 N 53/02 // C07D 521/00

(7) Anmelder:

Bayer AG, 51373 Leverkusen, DE

(72) Erfinder:

Elbe, Hans-Ludwig, Dr., 42329 Wuppertal, DE; Dutzmann, Stefan, Dipl.-Agr.-Ing. Dr., 40721 Hilden, DE; Stenzel, Klaus, Dipl.-Biol. Dr., 40595 Düsseldorf,

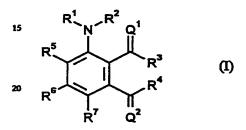
(54) Aminophthalsäurederivate

Die vorliegende Anmeldung betrifft die Verwendung von Aminophthalsaurederivaten als Fungizide, sowie neue Aminophthalsäurederivate und mehrere Verfahren zu deren Herstellung.

Beschreibung

Die vorliegende Anmeldung betrifft die Verwendung von Aminophthalsäurederivaten als Fungizide, sowie neue Aminophthalsäurederivate und mehrere Verfahren zu deren Herstellung.

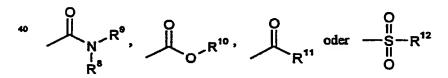
- Bestimmte Aminophthalsäurederivate, wie beispielsweise 3-Acetylamino-phthalsäuredimethylester, 3-Aminophthalsäuredimethylester, 3-Aminophthalsäure-1-methylester, 3-Aminophthalsäure-2-methylester, 3-Aminophthalsäure-2-methylester und 3-Aminophthalsäure, sind bereits aus der chemischen Literatur bekannt (vergleiche z. B. J. Heterocycl. Chem. (1973) 891—9, J. Amer. Chem. Soc., (1937) 2580—3, Justus Liebigs Ann. Chem., (1881) 246, J. Amer. Chem. Soc., (1909) 486, J. Med. Chem. (1988) 1466—1471, Chem. Ber., (1886), 166, JP 04182460).
- Eine fungizide Wirkung dieser Verbindungen ist aber bisher nicht beschrieben worden. Es wurde nun gefunden, daß die Aminophthalsäurederivate der allgemeinen Formel (I),



- in welcher
 Q¹ und Q² gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Sauerstoff oder Schwefel stehen,
 R¹ für Wasserstoff oder die Gruppierung
- 30 P11

10

35 steht, worin R¹¹ die unten angegebene Bedeutung hat, R² für Wasserstoff oder eine der nachfolgenden Gruppierungen

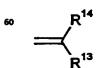


steht, worin

45

R⁸ für Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl, jeweils gegebenenfalls substituiertes Aryl oder Heteroaryl steht,

- R⁹ für Wasserstoff oder Alkyl steht, oder
 50 R⁸ und R⁹ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes
 Heterocyclyl stehen,
 - R¹⁰ für gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Aryl oder Cycloalkyl substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl oder für Heterocyclyl steht,
 - R¹¹ für Wasserstoff oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Aryl, Arylalkyl oder Heterocyclyl steht,
- R¹² für Alkyl, Aryl oder Heterocyclyl steht, oder R¹ und R² gemeinsam für eine Gruppierung



stehen, worin R¹³ für Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl oder gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl steht und

R¹⁴ für Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Aryl, Heterocyclyl, Alkoxy oder Dialkylamino steht oder

R¹³ und R¹⁴ gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für Cycloalkyliden stehen, oder R¹ und R² gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl stehen,

R³ und R⁴ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Arylalkoxy, Cycloalkoxy, Cycloalkenyloxy, Aryloxy, Heterocyclyloxy, Mercapto, Alkylthio, Alkenylthio, Alkinylthio, Arylalkylthio, Cycloalkenylthio, Arylthio, Heterocyclylthio oder

stehen, wobei

 $m R^{15}$ für Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl, jeweils gegebenenfalls substituiertes Aryl oder Heteroaryl steht, $m R^{16}$ für Wasserstoff oder Alkyl steht, oder

R¹⁵ und R¹⁶ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes 20 Heterocyclyl stehen und

R⁵, R⁶ und R⁷ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Halogenalkyl, Halogenalkoxy oder Halogenalkylthio stehen, gut zur Bekämpfung von Schädlingen verwendet werden können.

Die Verbindungen der Formel (I) wiesen dabei eine sehr starke fungizide Wirkung im Pflanzenschutz auf. In den Definitionen sind die gesättigten oder ungesättigten Kohlenwasserstoffketten, wie Alkyl oder Alkenyl, auch in Verknüpfung mit Heteroatomen, wie in Alkoxy, Alkylthio oder Alkylamino, jeweils geradkettig oder verzweiet

25

45

55

Halogen steht im allgemeinen für Fluor, Chlor, Brom oder Iod, vorzugsweise für Fluor, Chlor oder Brom, insbesondere für Fluor oder Chlor.

Aryl steht für aromatische, mono- oder polycyclische Kohlenwasserstoffringe, wie z. B. Phenyl, Naphthyl, Anthranyl, Phenanthryl, vorzugsweise Phenyl oder Naphthyl, insbesondere Phenyl.

Heterocyclyl steht für gesättigte oder ungesättigte, sowie aromatische, ringförmige Verbindungen, in denen mindestens ein Ringglied ein Heteroatom, d. h. ein von Kohlenstoff verschiedenes Atom, ist. Enthält der Ring mehrere Heteroatome, können diese gleich oder verschieden sein. Enthält der Ring mehrere Sauerstoffatome, 35 stehen diese nicht benachbart. Heteroatome sind bevorzugt Sauerstoff, Stickstoff oder Schwefel.

Cycloalkyl steht für gesättigte; carbocyclische, ringförmige Verbindungen.

Cycloalkenyl steht für carbocyclische, ringförmige Verbindungen, die mindestens eine Doppelbindung enthalten.

Alle genannten ringförmigen Verbindungen bilden gegebenenfalls mit weiteren carbocyclischen oder heterocyclischen, ankondensierten oder überbrückten Ringen gemeinsam ein polycyclisches Ringsystem.

Überraschenderweise zeigen die in dieser Anmeldung genannten Stoffe eine viel stärkere fungizide Wirkung als konstitutionell ähnliche Verbindungen, wie beispielsweise Benzoesäure, mit gleicher Wirkungsrichtung.

Bevorzugt ist die Verwendung der Verbindungen der Formel (I), in welcher Q¹ und Q² gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Sauerstoff oder Schwefel stehen, R¹ für Wasserstoff oder die Gruppierung

steht, worin \mathbb{R}^{11} die unten angegebene bevorzugte Bedeutung hat, steht, \mathbb{R}^2 für Wasserstoff oder eine der nachfolgenden Gruppierungen

steht, worin

R⁸ für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, jeweils
gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Halogen, Alkyl, Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen,
Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1—5 gleichen oder verschiedenen

Halogenatomen, substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocycyl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht,

R9 für Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, oder

R8 und R9 gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes

Heterocyclyl mit 3 bis 7 Ringgliedern stehen,

R¹⁰ für gegebenenfalls durch Phenyl oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen substituiertes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkinyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen oder für Heterocyclyl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht,

R11 für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls durch Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyl oder Carboxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 5 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 2 bis 5 Kohlenstoffatomen, Alkinyl mit 2 bis 5 Kohlenstoffatomen oder jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen oder Halogen substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Aryl, Arylalkyl oder Heterocyclyl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht,

R12 für Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Phenyl, Naphthyl oder Heterocyclyl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht,

s oder

R1 und R2 gemeinsam für eine Gruppierung

stehen, worin

R¹³ für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Alkyl, Alkoxy, Halogen, Cyano oder Nitro substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocyclyl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht und

R¹⁴ für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Phenyl, Naphthyl, Heterocyclyl mit 3 bis 7 Ringgliedern, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylteilen steht oder

R¹³ und R¹⁴ gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für Cycloalkyliden mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen stehen oder

R¹ und R² gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl mit 3 bis 7 Ringgliedern stehen,

R³ und R⁴ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy mit 1 bis 12 Kohlenstoffatomen, Alkenyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen, Alkinyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen, Phenylalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Cycloalkoxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyloxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Phenoxy, Heterocyclyloxy mit 3 bis 7 Ringgliedern, Mercapto, Alkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkenylthio mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkinylthio mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Arylalkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Cycloalkylthio mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenylthio mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Phenylthio, Heterocyclylthio mit 3 bis 7 Ringgliedern oder

stehen, wobei

R¹⁵ für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Halogen, Alkyl, Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1—5 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocycyl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht,

R¹⁶ für Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, oder R¹⁵ und R¹⁶ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiertes Heterocyclyl mit 3 bis 7 Ringgliedern stehen, und

R⁵, R⁶ und R⁷ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl, Halogenalkoxy oder Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen stehen.

Besonders bevorzugt ist die Verwendung der Verbindungen der Formel (I), in welcher QI und Q2 gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Sauerstoff oder Schwefel stehen, RI für Wasserstoff oder die Gruppierung

steht

worin R11 die unten angegebene, besonders bevorzugte Bedeutung hat, steht, R² für Wasserstoff oder eine der nachfolgenden Gruppierungen

10

15

5

R8 für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, 20 Cyclohexyl oder jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Difluormethoxy oder Difluorchlormethoxy, substituiertes Phenyl, Naphthyl, Thienyl, Pyridyl oder Furyl steht,

R9 für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl steht, oder

R8 und R9 gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls einfach bis dreifach 25 durch Methyl substituiertes Pyrrolyl, Piperidyl, Morpholinyl oder Piperazinyl stehen,

R¹⁰ für Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Benzyl, 1-Phenylethyl, 2-Phenylethyl, Cyclohexylme-

thyl, Allyl, Propargyl, Oxethan-3-yl steht,

Ril für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls durch Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Acetyl oder Carboxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Vinyl, Allyl, Propargyl, Penta-1,3-dien-1-yl 30 oder jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Phenyl, Benzyl, Thienyl, Furyl, Pyrazolyl, Pyridyl oder 2,3-Dihydro[1,4]oxathiin steht,

R12 für Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Phenyl, Naphthyl, Thienyl, Furyl oder Pyridyl steht, oder

R1 und R2 gemeinsam für eine Gruppierung

40

R13 für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Vinyl, Allyl, Propargyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopentenyl, Cyclohexenyl, Phenyl, Methylphenyl, Fluorphenyl, Chlorphenyl, Bromphenyl, Cyanphenyl, Methoxyphenyl, Nitrophenyl, Thienyl, Furyl, Pyridyl oder Chlorpyridyl steht

R14 für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Allyl, Propargyl, Cyclopropyl, Cyclobu- 50 tyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Phenyl, Thienyl, Furyl oder Pyridyl, Methoxy, Ethoxy, Dimethylamino, Diethylamino steht oder

R¹³ und R¹⁴ gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für Cyclopropyliden, Cyclobutyliden, Cyclopentyliden oder Cyclohexyliden stehen, oder

R1 und R2 gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls einfach bis dreifach 55 durch Methyl substituiertes Pyrrolyl, Piperidyl, Morpholinyl, Piperazinyl oder Succinimidyl stehen,

R3 und R4 gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Pentoxy, Hexyloxy, Heptyloxy, Octyloxy, Nonyloxy, Decyloxy, Undecyloxy, Dodecyloxy, Allyloxy, Propargyloxy, Benzyloxy, Cyclopentyloxy, Cyclohexenyloxy, Phenoxy, Oxetan-3-yloxy, Mercapto, Methylthio, Ethylthio, Allylthio, Propargylthio, Benzylthio, Cyclopentylthio, Cyclohexylthio, Cyclohexenylthio, Phenylthio, Amino, Methylamino, Ethylamino, Dimethylamino, Phenylamino oder über ein Stickstoffatom gebundenes, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl substituiertes

Pyrrolyl, Piperidyl, Morpholinyl oder Piperazinyl stehen und R⁵, R⁶ und R⁷ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluormethylthio, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio stehen.

Diese Restedefinitionen können untereinander, also auch zwischen den angegebenen Bereichen bevorzugter

Verbindungen, beliebig kombiniert werden.

Bevorzugt verwendbare Verbindungen sind auch Additionsprodukte aus Säuren und denjenigen Aminophthalsäurederivaten der Formel (I), in denen R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, Q¹ und Q² diejenigen Bedeutungen haben, die für diese Reste als bevorzugt genannt wurden.

Zu den Säuren, die addiert werden können, gehören vorzugsweise Halogenwasserstoffsäuren, wie z. B. die Chlorwasserstoffsäure und die Bromwasserstoffsäure, insbesondere die Chlorwasserstoffsäure, ferner Phosphorsäure, Schwefelsäure, Salpetersäure, mono- und bifunktionelle Carbonsäuren und Hydroxycarbonsäuren, wie z. B. Essigsäure, Maleinsäure, Bernsteinsäure, Fumarsäure, Weinsäure, Zitronensäure, Salicylsäure, Sorbinsäure und Milchsäure, sowie Sulfonsäuren, wie z. B. p-Toluolsulfonsäure, 1,5-Naphthalindisulfonsäure, Saccharin und Thiosaccharin.

Weiterhin Gegenstand der vorliegenden Anmeldung sind neue Aminophthalsäurederivate der allgemeinen Formel (I-a),

in welcher

R¹⁷ und R¹⁸ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Arylalkoxy, Cycloalkoxy, Cycloalkenyloxy, Aryloxy, Heterocyclyloxy oder

stehen, wobei

R¹⁹ für Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl, jeweils gegebenenfalls substituiertes Aryl oder Heteroaryl steht,

R²⁰ für Wasserstoff oder Alkyl steht, oder

R¹⁹ und R²⁰ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl stehen,

wobei die Verbindungen

3-Aminophthalsäuredimethylester,

3-Aminophthalsäurediethylester,

3-Aminophthalsäuredi-n-propylester,

45 3-Aminophthalsäure-1-methylester,

3-Aminophthalsäure-2-methylester,

3-Aminophthalsäure,

3-Aminophthalamid,

2-(N-Methyl-N-phenyl-carbamoyl)-6-amino-benzanilid,

1,2-Bis-(N-methyl-N-phenyl-carbamoyl)-3-amino-benzol und

2-(N-Methyl-N-phenyl-carbamoyl)-3-carbomethoxy-anilin,

ausgenommen sind.

Bevorzugt sind neue Verbindungen der Formel (I-a), in welcher

R¹⁷ und R¹⁸ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy mit 1 bis 12 Kohlenstoffatomen, Alkenyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen, Alkinyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen, Phenylalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Cycloalkoxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyloxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Phenoxy, Heterocyclyloxy mit 3 bis 7 Ringgliedern, oder

stehen, wobei

R¹⁹ für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Halogen, Alkyl, Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen,

Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1-5 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocycyl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht.

R²⁰ für Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, oder

R¹⁹ und R²⁰ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiertes Heterocyclyl mit 3 bis 7 Ringgliedern stehen.

Besonders bevorzugt sind neue Verbindungen der Formel (I-a), in welcher

R¹⁷ und R¹⁸ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Methoxy, Ethoxy, n- oder
i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Pentoxy, Hexyloxy, Heptyloxy, Octyloxy, Nonyloxy, Decyloxy, Undecyloxy,
Dodecyloxy, Allyloxy, Propargyloxy, Benzyloxy, Cyclopentyloxy, Cyclohexyloxy, Cyclohexenyloxy, Phenoxy,
Oxetan-3-yloxy, Amino, Methylamino, Ethylamino, Dimethylamino, Phenylamino oder über ein Stickstoffatom
gebundenes, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl substituiertes Pyrrolyl, Piperidyl, Morpholinyl oder Piperazinyl stehen.

Ebenfalls Gegenstand der vorliegenden Anmeldung sind neue Aminophthalsäurederivate der allgemeinen Formel (I-b).

15

20

25

30

55

65

 R^{21} R^{22} R^{23} R^{24} R^{24}

in welcher
R²¹ für Wasserstoff oder die Gruppierung

R²⁵

steht, worin \mathbb{R}^{25} die unten angegebene Bedeutung hat, \mathbb{R}^{22} für die Gruppierung

0 R²⁵

steht, worin

R²⁵ für Wasserstoff oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl,

Aryl, Arylalkyl oder Heterocyclyl steht,

R²³ und R²⁴ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy, Alkoxy, Alkoxy, Alkinyloxy,

Alkinyloxy, Arylalkoxy, Cycloalkoxy, Cycloalkenyloxy, Aryloxy, Heterocyclyloxy stehen, wobei R²³ und R²⁴ nicht

50 gleichzeitig für Hydroxy stehen und die Verbindungen

3-Acetylamino-phthalsäuredimethylester und

3-Acetylamino-phthalsäure-1-methylester ausgenommen sind. Bevorzugt sind neue Verbindungen der Formel (l-b), in welcher R²¹ für Wasserstoff oder die Gruppierung

R²⁵

steht, worin R²⁵ die unten angegebene bevorzugte Bedeutung hat, R²² für die Gruppierung

steht, worin

R²⁵ für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls durch Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyl oder Carboxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 5 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 2 bis 5 Kohlenstoffatomen, Alkinyl mit 2 bis 5 Kohlenstoffatomen oder jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen oder Halogen substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Aryl, Arylalkyl oder Heterocyclyl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht,

Ringgliedern steht,

R²³ und R²⁴ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy mit 1 bis 12

Kohlenstoffatomen, Alkenyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen, Alkinyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen,

Phenylalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Cycloalkoxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyloxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Phenoxy, Heterocyclyloxy mit 3 bis 7 Ringgliedern stehen, wobei R²³

und R²⁴ nicht gleichzeitig für Hydroxy stehen.

Besonders bevorzugt sind neue Verbindungen der Formel (I-b), in welcher

20 R²¹ für Wasserstoff oder die Gruppierung

steht

worin R²⁵ die unten angegebene besonders bevorzugte Bedeutung hat, R²² für die Gruppierung

steht, worin

50

R²⁵ für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls durch Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Acetyl oder Carboxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Vinyl, Allyl, Propargyl, Penta-1,3-dien-1-yl oder jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclobexyl, Phenyl, Benzyl, Thienyl, Furyl, Pyrazolyl, Pyridyl oder 2,3-Dihydro[1,4]oxathiin steht,

R²³ und R²⁴ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Pentoxy, Hexyloxy, Octyloxy, Octyloxy, Nonyloxy, Decyloxy, Undecyloxy, Dodecyloxy, Allyloxy, Propargyloxy, Benzyloxy, Cyclopentyloxy, Cyclohexyloxy, Cyclohexenyloxy, Phenoxy oder Oxetan-3-yloxy stehen, wobei R²³ und R²⁴ nicht gleichzeitig für Hydroxy stehen.

Weiterhin Gegenstand der vorliegenden Anmeldung sind neue Aminophthalsäurederivate der allgemeinen Formel (I-c),

in welcher

R²⁶ für Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl, jeweils gegebenenfalls substituiertes Aryl oder Heteroaryl steht, R²⁷ für Wasserstoff oder Alkyl steht, oder

 \mathbb{R}^{26} und \mathbb{R}^{27} gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl stehen und

R²⁸ und R²⁹ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Arylalkoxy, Cycloalkoxy, Cycloalkenyloxy, Aryloxy, Heterocyclyloxy stehen.

Bevorzugt sind neue Verbindungen der Formel (I-c), in welcher

R26 für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Halogen, Alkyl, Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1-5 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocycyl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht,

R27 für Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, oder

R²⁶ und R²⁷ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl mit 3 bis 7 Ringgliedern stehen und

R²⁸ und R²⁹ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy mit 1 bis 12 Kohlenstoffatomen, Alkenyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen, Alkinyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen, Phenylalkoxy mit 1 bis 12 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Cycloalkoxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyloxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Phenoxy oder Heterocyclyloxy mit 3 bis 7 Ringgliedern stehen.

Besonders bevorzugt sind neue Verbindungen der Formel (I-c), in welcher

R²⁶ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl oder jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Difluormethoxy oder Difluorchlormethoxy, substituiertes Phenyl, Naphthyl, Thienyl, Pyridyl oder Furyl steht,

R27 für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl steht, oder

 R^{26} und R^{27} gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl substituiertes Pyrrolyl, Piperidyl, Morpholinyl oder Piperazinyl stehen und

R²⁸ und R²⁹ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Pentoxy, Hexyloxy, Octyloxy, Nonyloxy, Decyloxy, Undecyloxy, Dodecyloxy, Allyloxy, Propargyloxy, Benzyloxy, Cyclopentyloxy, Cyclohexyloxy, Cyclohexenyloxy, Phenoxy 25 oder Oxetan-3-yloxy stehen.

Weiterhin Gegenstand der vorliegenden Anmeldung sind neue Aminophthalsäurederivate der allgemeinen Formel (I-d),

in welcher

R³⁰ für gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl steht und

R³¹ für Hydroxy oder

steht, wobei

R32 für Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl, jeweils gegebenenfalls substituiertes Aryl oder Heteroaryl steht,

R33 für Wasserstoff oder Alkyl steht, oder

R³² und R³³ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl stehen.

Bevorzugt sind neue Verbindungen der Formel (I-d), in welcher

R³⁰ für gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen oder Halogen substituiertes Heterocyclyl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht und

R31 für Hydroxy oder

65

steht, wobei

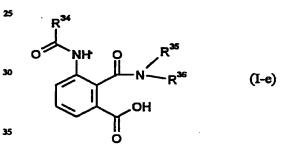
R³² für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Halogen, Alkyl, Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1—5 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocycyl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht, R³³ für Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, oder

R³² und R³³ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiertes Heterocyclyl mit 3 bis 7 Ringgliedern stehen.

Besonders bevorzugt sind neue Verbindungen der Formel (I-d), in welcher R³⁰ für für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Thienyl, Furyl, Pyrazolyl, Pyridyl oder 2,3-Dihydro[1,4]oxathiin steht und

R³¹ für Hydroxy, Amino, Methylamino, Ethylamino, Dimethylamino, Phenylamino oder über ein Stickstoffatom gebundenes, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl substituiertes Pyrrolyl, Piperidyl, Morpholinyl oder Piperazinyl steht.

Weiterhin Gegenstand der vorliegenden Anmeldung sind neue Aminophthalsäurederivate der allgemeinen Formel (I-e),



in welcher

R34 für Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl oder Aryl steht.

R35 für Wasserstoff oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, Aryl oder Heteroaryl steht, R36 für Wasserstoff oder Alkyl steht, oder

R³⁵ und R³⁶ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl stehen.

Bevorzugt sind neue Verbindungen der Formel (I-e), in welcher

45 R34 für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls durch Alkoxycarbonyl substituiertes Alkyl mit 1 bis 5 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 2 bis 5 Kohlenstoffatomen oder jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen oder Halogen substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Aryl oder Arylalkyl steht,

50 R35 für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Halogen, Alkyl, Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1-5 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocycyl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht, R36 für Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, oder

R35 und R36 gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiertes Heterocyclyl mit 3 bis 7 Ringgliedern stehen.

Besonders bevorzugt sind neue Verbindungen der Formel (I-e), in welcher

R³⁴ für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls durch Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Vinyl, Allyl, Propargyi, Penta-1,3-dien-1-yl oder jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclobexyl, Phenyl oder Benzyl steht,

R35 für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Phenyl, Cyclopropyl oder Oxethan-3-yl steht,

R36 für Wasserstoff oder Methyl steht, oder

R35 und R36 gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl substituiertes Pyrrolyl, Piperidyl, Morpholinyl oder Piperazinyl stehen.

Ebenfalls Gegenstand der vorliegenden Anmeldung sind neue Aminophthalsäurederivate der allgemeinen Formel (I-f),

R³⁷ für Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl oder gegebenen15 falls substituiertes Heterocyclyl steht und

R³⁸ für Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Aryl, Heterocyclyl, Alkoxy oder Dialkylamino steht oder

R³⁷ und R³⁸ gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für Cycloalkyliden stehen, und R³⁹ und R⁴⁰ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy, Alkenyloxy, 20 Alkinyloxy, Arylalkoxy, Cycloalkoxy, Cycloalkenyloxy, Aryloxy, Heterocyclyloxy, Mercapto, Alkylthio, Alkenylthio, Alkinylthio, Arylalkylthio, Cycloalkylthio, Cycloalkenylthio, Arylthio, Heterocyclylthio oder

30

stehen, wobei

R41 für Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl, jeweils gegebenenfalls substituiertes Aryl oder Heteroaryl steht,

R⁴² für Wasserstoff oder Alkyl steht, oder

R⁴¹ und R⁴² gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl stehen.

Bevorzugt sind neue Verbindungen der Formel (I-f), in welcher

R³⁷ für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Alkyl, Alkoxy, Halogen, Cyano oder Nitro substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocyclyl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht und

R³⁸ für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Phenyl, Heterocyclyl mit 3 bis 7 Ringgliedern, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylketten steht oder

R³⁷ und R³⁸ gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für Cycloalkyliden mit 3 bis 8 45 Kohlenstoffatomen stehen, und

R³⁹ und R⁴⁰ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy mit 1 bis 12 Kohlenstoffatomen, Alkenyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen, Alkinyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen, Phenylalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Cycloalkoxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyloxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Phenoxy, Heterocyclyloxy mit 3 bis 7 Ringgliedern, Mercapto, Alkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkinylthio mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Arylalkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Cycloalkylthio mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenylthio mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Phenylthio, Heterocyclylthio mit 3 bis 7 Ringgliedern oder

stehen, wobei

R⁴¹ für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Halogen, Alkyl, Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1—5 gleichen oder verschiedenen 65 Halogenatomen, substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocycyl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht, R⁴² für Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, oder

R41 und R42 gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls einfach bis dreifach

durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiertes Heterocyclyl mit 3 bis 7 Ringgliedern stehen.

Besonders bevorzugt sind neue Verbindungen der Formel (I-f), in welcher

R³⁷ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Vinyl, Allyl, Propargyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclopentenyl, Cyclopentenyl, Phenyl, Methylphenyl, Fluorphenyl, Chlorphenyl, Bromphenyl, Cyanphenyl, Methoxyphenyl, Nitrophenyl, Thienyl, Furyl, Pyridyl oder Chlorpyridyl steht und

R³⁸ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, s-, i- oder t-Butyl, Vinyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclopentenyl, Cyclohexenyl, Phenyl, Thienyl oder Pyridyl, Methoxy, Ethoxy, Dimethylamino oder Diethylamino steht oder

R³⁷ und R³⁸ gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für Cyclopentyliden oder Cyclohex-

yliden stehen, und R⁴⁰ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Pentoxy, Hexyloxy, Heptyloxy, Octyloxy, Nonyloxy, Decyloxy, Undecyloxy, Dodecyloxy, Allyloxy, Propargyloxy, Benzyloxy, Cyclopentyloxy, Cyclohexenyloxy, Cyclohexenyloxy, Phenoxy, Oxetan-3-yloxy, Mercapto, Methylthio, Ethylthio, Allylthio, Propargylthio, Benzylthio, Cyclohexenylthio, Cyclohexenylthio, Phenylthio, Amino, Methylamino, Ethylamino, Dimethylamino, Phenylamino oder über ein Stickstoffatom gebundenes, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl substituiertes Pyrrolyl, Piperidyl, Morpholinyl oder Piperazinyl stehen.

Die Verbindungen der Formel (I-a) werden erhalten (Verfahren a), wenn man Nitrophthalsäurederivate der

Formel (II)

in welcher

30

R¹⁷ und R¹⁸ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit einem Reduktionsmittel, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, und gegebenenfalls in

Gegenwart eines Katalysators, umsetzt.

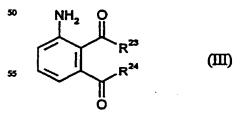
Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens a) als Ausgangsstoffe benötigten Nitrophthalsäurederivate sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In dieser Formel (II) haben R¹⁷ und R¹⁸ vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I-a) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R¹⁷ und R¹⁸ angegeben wurden.

Die Ausgangsstoffe der Formel (II) sind bekannt (vergleiche z. B. Bull. Soc. Chim. Fr. (1968), 4947—53; Chem. Ber., (1902) 3872, Anal. Chem., (1994) 1302—1315) und/oder können nach an sich bekannten Verfahren herge-

stellt werden (siehe auch die Herstellungsbeispiele).

Als Reduktionsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens a) kommen alle für derartige Reaktionen übliche Stoffe in Frage. Vorzugsweise seien genannt: Wasserstoff, Metalle, wie beispielsweise Zink, Eisen oder Zinn; oder Salze, wie beispielsweise Zinn-(II)-chlorid, Natriumdithionit oder Natriumhydrogensulfid.

Die Verbindungen der Formel (I-b) werden erhalten (Verfahren b), wenn man Aminoverbindungen der Formel (III)



o in welcher

R²³ und R²⁴ die oben angegebenen Bedeutungen haben, mit einem Säurehalogenid der Formel (IV)

196 23 744 A1 DE

in welcher R²⁵ die oben angegebene Bedeutung hat und X für Halogen steht, oder mit einem Säureanhydrid der Formel (V)

(V)

in welcher

R²⁵ die oben angegebene Bedeutung hat, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzep-

oder wenn man (Verfahren c) Nitroverbindungen der Formel (VI)

in welcher

R²³ und R²⁴ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

in Gegenwart eines Säureanhydrids der Formel (V) mit Wasserstoff, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdün- 30

nungsmittels und in Gegenwart eines Katalysators, umsetzt.
Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens b) als Ausgangsstoffe benötigten Aminoverbindungen sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In dieser Formel (III) haben R²³ und R²⁴ vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I-b) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R²³ und R²⁴ angegeben 35 wurden.

Die Ausgangsstoffe der Formel (III) sind entweder bekannt und können nach an sich bekannten Verfahren erhalten werden (vergleiche z. B. J. Heterocycl. Chem. (1973) 891 - 9, J. Amer. Chem. Soc., (1937) 2580 - 3, Justus Liebigs Ann. Chem. (1881) 246, J. Amer. Chem. Soc. (1909) 486, J. Med. Chem. (1988) 1466-1471, Chem. Ber. (1886), 166) oder sind erfindungsgemäße Verbindungen der Formel (I-a) und können nach Verfahren a) herge- 40 stellt werden.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens b) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Säurehalogenide sind durch die Formel (IV) allgemein definiert. In dieser Formel (IV) hat R25 vorzugsweise bzw. insbesondere die jenige Bedeutung, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I-b) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R²⁵ angegeben wurde. X steht 45 für Halogen, vorzugsweise für Chlor.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens b) alternativ als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Säureanhydride sind durch die Formel (V) allgemein definiert. In dieser Formel (V) hat R25 vorzugsweise bzw. insbesondere diejenige Bedeutung, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I-b) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R²⁵ angegeben wurde.

Die Säurehalogenide der Formel (IV) und die Säureanhydride der Formel (V) sind bekannte Synthesechemika-

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens c) als Ausgangsstoffe benötigten Nitroverbindungen sind durch die Formel (VI) allgemein definiert. In dieser Formel (VI) haben R²³ und R²⁴ vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I-b) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R²³ und R²⁴ angegeben

Die Ausgangsstoffe der Formel (VI) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vergleiche z. B. Bull. Soc. Chim. Fr. (1968), 4947 – 53; Chem. Ber., (1902) 3872, JP 04182460).

Die Verbindungen der Formel (I-c) werden erhalten (Verfahren d), wenn man Aminoverbindungen der Formel 60 (VII)

65

5

10

20

R²⁵ und R²⁹ die oben angegebenen Bedeutungen haben, mit einem Isocyanat der Formel (VIII)

$$R^{26}-N=C=O$$
 (VIII)

in welcher

R²⁶ die oben angegebene Bedeutung hat, oder mit einem Carbamoylchlorid der Formel (IX)

 $R \stackrel{O}{\underset{R}{\downarrow}_{28}} CI \qquad (IX)$

in welcher

R²⁶ und R²⁷ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors, umsetzt.

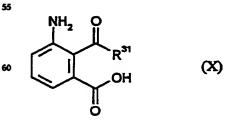
Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens d) als Ausgangsstoffe benötigten Aminoverbindungen sind durch die Formel (VII) allgemein definiert. In dieser Formel (VII) haben R²⁸ und R²⁹ vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I-c) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R²⁸ und R²⁹ angegeben wurden.

Die Ausgangsstoffe der Formel (VII) sind entweder bekannt und können nach an sich bekannten Verfahren erhalten werden (vergleiche z. B. J. Heterocycl. Chem. (1973) 891—9, J. Amer. Chem. Soc., (1937) 2580—3, Justus Liebigs Ann. Chem., (1881) 246, J. Amer. Chem. Soc., (1909) 486, J. Med. Chem. (1988) 1466—1471, Chem. Ber., (1886), 166) oder sind erfindungsgemäße Verbindungen der Formel (I-a) und können nach Verfahren a) hergestellt werden.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens d) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Isocyanate sind durch die Formel (VIII) allgemein definiert. In dieser Formel (VIII) hat R²⁶ vorzugsweise bzw. insbesondere diejenige Bedeutung, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I-c) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R²⁶ angegeben wurde.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens d) alternativ als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Carbamoylchloride sind durch die Formel (XIX) allgemein definiert. In dieser Formel (IX) haben R²⁶ und R²⁷ vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I-c) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R²⁶ und R²⁷ angegeben wurden.

Die Isocyanate der Formel (VIII) und die Säureanhydride der Formel (IX) sind bekannte Synthesechemikalien. Die Verbindungen der Formel (I-d) werden erhalten (Verfahren e), wenn man Aminoverbindungen der Formel (X)



in welcher

R³¹ die oben angegebene Bedeutung hat, mit einem Säurehalogenid der Formel (XI)

R³⁰ die oben angegebene Bedeutung hat und

Y für Halogen steht,

oder mit einem Säureanhydrid der Formel (XII)

5

10

40

55

65

in welcher

R30 die oben angegebene Bedeutung hat,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzep- 20 tors. umsetzt.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens e) als Ausgangsstoffe benötigten Aminoverbindungen sind durch die Formel (X) allgemein definiert. In dieser Formel (X) hat R³¹ vorzugsweise bzw. insbesondere diejenige Bedeutung, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I-d) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R³¹ angegeben wurde.

Die Ausgangsstoffe der Formel (X) sind eine Untergruppe der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel

(I-a) und können nach Verfahren a) hergestellt werden.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens e) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Säurehalogenide sind durch die Formel (XI) allgemein definiert. In dieser Formel (XI) hat R³⁰ vorzugsweise bzw. insbesondere diejenige Bedeutung, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen verbindungen der Formel (I-d) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R³⁰ angegeben wurde. Y steht für Halogen, vorzugsweise für Chlor.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens e) alternativ als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Säureanhydride sind durch die Formel (XII) allgemein definiert. In dieser Formel (XII) hat R³⁰ vorzugsweise bzw. insbesondere diejenige Bedeutung, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I-d) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R³⁰ angegeben wurde.

Die Säurehalogenide der Formel (XI) und die Säureanhydride der Formel (XII) sind bekannte Synthesechemi-

Die Verbindungen der Formel (I-e) werden erhalten (Verfahren f), wenn man Aminoverbindungen der Formel (XIII)

$$\begin{array}{c|c} NH_2 & O & R^{35} \\ \hline & N & R^{36} \\ \hline & OH \\ \hline & OH \\ \end{array} \tag{XIIII)}$$

in welcher

 ${
m R}^{35}$ und ${
m R}^{36}$ die oben angegebenen Bedeutungen haben, mit einem Säurehalogenid der Formel (XIV)

in welcher

R34 die oben angegebene Bedeutung hat und

Z für Halogen steht,

oder mit einem Säureanhydrid der Formel (XV)

$$R^{34} = \begin{pmatrix} 0 & 0 & 0 \\ 0 & 0 & 0 \\ 0 & 0 & 0 \end{pmatrix}$$
 (XV)

R34 die oben angegebene Bedeutung hat,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors, umsetzt.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens f) als Ausgangsstoffe benötigten Aminoverbindungen sind durch die Formel (XIII) allgemein definiert. In dieser Formel (XIII) haben R³⁵ und R³⁶ vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I-e) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R³⁵ und R³⁶ angegeben wurden.

Die Ausgangsstoffe der Formel (XIII) sind eine Untergruppe der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I-a) und können nach Verfahren a) hergestellt werden.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens f) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Säurehalogenide sind durch die Formel (XIV) allgemein definiert. In dieser Formel (XIV) hat R³⁴ vorzugsweise bzw. insbesondere die jenige Bedeutung, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I-e) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R³⁴ angegeben wurde. Z steht für Halogen, vorzugsweise für Chlor.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens f) alternativ als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Säureanhydride sind durch die Formel (XV) allgemein definiert. In dieser Formel (XV) hat R³⁴ vorzugsweise bzw. insbesondere diejenige Bedeutung, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I-e) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R³⁴ angegeben wurde.

Die Säurehalogenide der Formel (XIV) und die Säureanhydride der Formel (XV) sind bekannte Synthesechemikalien.

Die Verbindungen der Formel (I-f) werden erhalten (Verfahren g), wenn man Aminoverbindungen der Formel (XVI)

in welcher

40

45

R³⁹ und R⁴⁰ die oben angegebenen Bedeutungen haben, mit einem Ketoderivat der Formel (XVII)

$$R^{37}$$
 W^1 (XVII)

in welcher

R³⁷ und R³⁸ die oben angegebenen Bedeutungen haben und

W¹ und W² für Alkoxy stehen, oder gemeinsam für ein zweifach gebundenes Sauerstoffatom stehen, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines sauren Katalysators, umsetzt.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens g) als Ausgangsstoffe benötigten Aminoverbindungen sind durch die Formel (XVI) allgemein definiert. In dieser Formel (XVI) haben R³⁹ und R⁴⁰ vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I-f) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R³⁹ und R⁴⁰ angegeben wurden.

Die Ausgangsstoffe der Formel (XVI) sind erfindungsgemäße Verbindungen der Formel (I-a) und können nach Verfahren a) hergestellt werden.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens g) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Ketoderivate sind durch die Formel (XVII) allgemein definiert. In dieser Formel (XVII) haben R³⁷ und R³⁸ vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der
erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I-f) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R³⁷ und

R³⁸ angegeben wurden. W¹ und W² stehen für Alkoxy, vorzugsweise für Methoxy oder Ethoxy, oder gemeinsam für ein zweifach gebundenes Sauerstoffatom.

Die Ketoderivate der Formel (XVII) sind bekannte Synthesechemikalien.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens a) kommen vorzugsweise in Frage: Ester, wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder i-Propanol, n-, i-, sek- oder tert-Butanol, Ethandiol, Propan-1,2-diol, Ethoxyethanol, Methoxyethanol, Diethylenglykolmonomethylether oder Diethylenglykolmonoethylether; Wasser, Salzlösungen, wie beispielsweise Ammoniumchloridlösung, wäßrige Säuren, wie beispielsweise Salzsäure oder Essigsäure, sowie beliebigen Mischungen der genannten Verdünnungsmittel.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren b), d), e) und f) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Ketone, wie Aceton, Butanon, Methyl-isobutylketon oder Cyclohexanon; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid; oder Sulfone, wie Sulfolan.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens c) kommen vorzugsweise in Frage: Ester, wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder i-Propanol, n-, i-, sek- oder tert-Butanol, Ethandiol, Propan-1,2-diol, Ethoxyethanol, Methoxyethanol, Diethylenglykolmonomethylether oder Diethylenglykolmonoethylether; oder organische Säuren, wie Essigsäure.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens g) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Dissopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Ketone, wie Aceton, Butanon, Methyl-isobutylketon oder Cyclohexanon; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n. oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid; oder Sulfone, wie Sulfolan.

Das erfindungsgemäße Verfahren a) wird gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators durchgeführt. 35 Vorzugsweise kommen alle für katalytische Hydrierungen übliche Metallzubereitungen in Betracht, wie beispielsweise Raney-Nickel, feinverteiltes Palladium oder Platin, gegebenenfalls auf einem Trägermaterial, wie Aktivkohle oder Calciumcarbonat.

Als Katalysator zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens c) kommen alle für katalytische Hydrierungen übliche Metallzubereitungen in Betracht, wie beispielsweise Raney-Nickel, feinverteiltes Palladium oder Platin, gegebenenfalls auf einem Trägermaterial, wie Aktivkohle oder Calciumcarbonat.

Die erfindungsgemäßen Verfahren b), d), e) und f) werden gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Säureakzeptors durchgeführt. Als solche kommen alle üblichen anorganischen oder organischen Basen in Frage. Hierzu gehören vorzugsweise Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydroxide, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat oder Natriumhydrogencarbonat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Das erfindungsgemäße Verfahren g) wird gegebenenfalls in Gegenwart eines sauren Katalysators durchgeführt. Als solche kommen alle anorganischen und organischen Protonen- wie auch Lewissäuren, sowie auch alle polymeren Säuren in Frage. Hierzu gehören beispielsweise Chlorwasserstoff, Schwefelsäure, Phosphorsäure, Ameisensäure, Essigsäure, Trifluoressigsäure, Methansulfonsäure, Trifluormethansulfonsäure, Toluolsulfonsäure, Bortrifluorid (auch als Etherat), Bortribromid, Aluminiumtrichlorid, Zinkchlorid, Eisen-III-chlorid, Antimonpentachlorid, saure Ionenaustauscher, saure Tonerden und saures Kieselgel.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren a) bis g) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 0°C bis 80°C.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens a) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I-a) setzt man pro Mol des Nitrophthalsäurederivates der Formel (II) im allgemeinen 1 bis 15 Mol, vorzugsweise 2 bis 8 Mol des Reduktionsmittels ein.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens b) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I-b) setzt man pro Mol der Aminoverbindung der Formel (III) im allgemeinen 1 bis 15 Mol, vorzugsweise 2 bis 8 Mol Säurehalogenid der Formel (IV) oder Säureanhydrid der Formel (V) ein.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens c) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I-b) setzt man pro Mol der Nitroverbindung der Formel (VI) im allgemeinen 1 bis 15 Mol, vorzugsweise 2 bis 8 Mol 65 Säureanhydrid der Formel (V) und 1 bis 100 Mol, vorzugsweise 1 bis 50 Mol Wasserstoff ein.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens d) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I-c) setzt man pro Mol der Aminoverbindung der Formel (VII) im allgemeinen 1 bis 15 Mol vorzugsweise 2 bis 8 Mol

Isocyanat der Formel (VIII) oder Carbamoylchlorid der Formel (IX) ein.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens e) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I-d) setzt man pro Mol der Aminoverbindung der Formel (X) im allgemeinen 1 bis 15 Mol, vorzugsweise 2 bis 8 Mol Säurehalogenid der Formel (XI) oder Säureanhydrid der Formel (XII) ein.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens f) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I-e) setzt man pro Mol der Aminoverbindung der Formel (XIII) im allgemeinen 1 bis 15 Mol, vorzugsweise 2 bis 8

Mol Säurehalogenid der Formel (XIV) oder Säureanhydrid der Formel (XV) ein.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens g) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I-f) setzt man pro Mol der Aminoverbindung der Formel (XVI) im allgemeinen 1 bis 15 Mol, vorzugsweise 2 bis 8 Mol Ketoverbindung der Formel (XIV) oder Säureanhydrid der Formel (XV) ein.

Alle erfindungsgemäßen Verfahren werden im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, unter erhöhtem oder vermindertem Druck – im allgemeinen zwischen 0,1 bar und 10 bar – zu

arbeiten.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe weisen eine starke mikrobizide Wirkung auf und können zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen praktisch eingesetzt werden. Die Wirkstoffe sind für den Gebrauch als Pflanzenschutzmittel, insbesondere als Fungizide geeignet.

Fungizide Mittel im Pflanzenschutz werden eingesetzt zur Bekämpfung von Plasmodiophoromycetes, Oomy-

cetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes, Deuteromycetes.

Bakterizide Mittel werden im Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae und Streptomycetaceae eingesetzt.

Beispielhaft aber nicht begrenzend seien einige Erreger von pilzlichen und bakteriellen Erkrankungen, die unter die oben aufgezählten Oberbegriffe fallen, genannt:

Xanthomonas-Arten, wie beispielsweise Xanthomonas campestris pv. oryzae;

Pseudomonas-Arten, wie beispielsweise Pseudomonas syringae pv. lachrymans;

25 Erwinia-Arten, wie beispielsweise Erwinia amylovora;

Pythium-Arten, wie beispielsweise Pythium ultimum;

Phytophthora-Arten, wie beispielsweise Phytophthora infestans;

Pseudoperonospora-Arten, wie beispielsweise Pseudoperonospora humuli oder Pseudoperonospora cubensis;

Plasmopara-Arten, wie beispielsweise Plasmopara viticola;

30 Bremia-Arten, wie beispielsweise Bremia lactucae;

Peronospora-Arten, wie beispielsweise Peronospora pisi oder P. brassicae;

Erysiphe-Arten, wie beispielsweise Erysiphe graminis;

Sphaerotheca-Arten, wie beispielsweise Sphaerotheca fuliginea;

Podosphaera-Arten, wie beispielsweise Podosphaera leucotricha;

35 Venturia-Arten, wie beispielsweise Venturia inaequalis;

Pyrenophora-Arten, wie beispielsweise Pyrenophora teres oder P. graminea (Konidienform: Drechslera, Syn: Helminthosporium);

Cochliobolus-Arten, wie beispielsweise Cochliob olus sativus (Konidienform: Drechslera, Syn: Helminthosporium);

Uromyces-Arten, wie beispielsweise Uromyces appendiculatus;

Puccinia-Arten, wie beispielsweise Puccinia recondita;

Sclerotinia-Arten, wie beispielsweise Sclerotinia sclerotiorum;

Tilletia-Arten, wie beispielsweise Tilletia caries;

Ustilago-Arten, wie beispielsweise Ustilago nuda oder Ustilago avenae;

45 Pellicularia-Arten, wie beispielsweise Pellicularia sasakii;

Pyricularia-Arten, wie beispielsweise Pyricularia oryzae;

Fusarium-Arten, wie beispielsweise Fusarium culmorum;

Botrytis-Arten, wie beispielsweise Botrytis cinerea;

Septoria-Arten, wie beispielsweise Septoria nodorum;

Leptosphaeria-Arten, wie beispielsweise Leptosphaeria nodorum;

Cercospora-Arten, wie beispielsweise Cercospora canescens;

Alternaria-Arten, wie beispielsweise Alternaria brassicae;

Pseudocercosporella-Arten, wie beispielsweise Pseudocercosporella herpotrichoides.

Die gute Pflanzenverträglichkeit der Wirkstoffe in den zur Bekämpfung von Pflanzenkrankheiten notwendigen Konzentrationen erlaubt eine Behandlung von oberirdischen Pflanzenteilen, von Pflanz- und Saatgut, und der Bodens

Dabei lassen sich die erfindungsgemäßen Wirkstoffe mit besonders gutem Erfolg zur Bekämpfung von Getreidekrankheiten, wie beispielsweise gegen Pseudocercosporella-Arten, oder von Krankheiten im Wein-, Obst- und Gemüseanbau, wie beispielsweise gegen Botrytis- und Plasmopara-Arten, einsetzen.

Die Wirkstoffe können in Abhängigkeit von ihren jeweiligen physikalischen und/oder chemischen Eigenschaften in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Schäume, Pasten, Granulate, Aerosole, Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen und in Hüllmassen für Saatgut, sowie ULV-Kalt- und Warmnebel-Formulierungen.

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z. B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden verflüssigten Gasen und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumerzeugenden Mitteln. Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z. B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel

kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol oder Alkylnaphthaline, chlorierte Aromaten oder chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z. B. Erdölfraktionen, Alkohole, wie Butanol oder Glycol sowie deren Ether und Ester, Ketone, wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser. Mit verflüssigten gasförmigen Streckmitteln oder Trägerstoffen sind solche Flüssigkeiten gemeint, welche bei normaler Temperatur und unter Normaldruck gasförmig sind, z. B. Aerosol-Treibgase, wie Halogenkohlenwasserstoffe sowie Butan, Propan, Stickstoff und Kohlendioxid. Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z. B. natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate. Als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z. B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit. Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnußschalen, Maiskolben und Tabakstengel. Als Emulgier und/oder schaumerzeugende Mittel kommen in Frage: z. B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäureester, Polyoxyethylen-Fettalkoholether, z. B. Alkylarylpolyglycolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate. Als Dispergiermittel kommen in Frage: z. B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulverige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine, und synthetische Phospholipide. Weitere 20 Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z. B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurennährstoffe, wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise 25 zwischen 0,5 und 90%.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Fungiziden, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden oder Insektiziden verwendet werden, um so z. B. das Wirkungsspektrum zu verbreitern oder Resistenzentwicklungen vorzubeugen. In vielen Fällen erhält man dabei synergistische Effekte, d. h. die Wirksamkeit der Mischung ist größer als die Wirksamkeit der Einzelkomponenten.

Als Mischpartner kommen zum Beispiel folgende Verbindungen in Frage:

Fungizide:

Aldimorph, Ampropylfos, Ampropylfos-Kalium, Andoprim, Anilazin, Azaconazol, Azoxystrobin,

Benalaxyl, Benodanil, Benomyl, Benzamacril, Benzamacryl-isobutyl, Bialaphos, Binapacryl, Biphenyl, Bitertanol, 35 Blasticdiin-S, Bromuconazol, Bupirimat, Buthiobat,

Calciumpolysulfid, Capsimycin, Captafol, Captan, Carbendazim, Carboxin, Carvon, Chinomethionat (Quinomethionat), Chlobenthiazon, Chlorfenazol, Chloroneb, Chloropicrin, Chlorothalonil, Chlozolinat, Clozylacon, Cufraneb, Cymoxanil, Cyproconazol, Cyprodinil, Cyprofuram,

Debacarb, Dichlorophen, Diclobutrazol, Diclofluanid, Diclomezin, Dicloran, Diethofencarb, Difenoconazol, Dimethirimol, Dimethomorph, Diniconazol, Diniconazol-M, Dinocap, Diphenylamin, Dipyrithione, Ditalimfos, Dithianon, Dodemorph, Dodine, Drazoxolon,

Ediphenphos, Epoxiconazol, Etaconazol, Ethirimol, Etridiazol,

Famoxadon, Fenapanil, Fenarimol, Fenbuconazol, Fenfuram, Fenitropan, Fenpicionil, Fenpropidin, Fenpropimorph, Fentinacetat, Fentinhydroxyd, Ferbam, Ferimzon, Fluazinam, Flumetover, Fluoromid, Fluquinconazol, Flurprimidol, Flusilazol, Flusulfamid, Flutolanil, Flutriafol, Folpet, Fosetyl-Alminium, Fosetyl-Natrium, Fthalid, Fuberidazol, Furalaxyl, Furametpyr, Furcarbonil, Furconazol, Furconazol-cis, Furmecyclox, Guazatin,

Hexachlorobenzol, Hexaconazol, Hymexazol,

Imazalil, Imibenconazol, Iminoctadin, Iminoctadinealbesilate, Iminoctadinetriacetate, Iodocarb, Ipconazol, Iprobenfos (IBP), Iprodione, Irumamycin, Isoprothiolan, Isovaledione,

Kasugamycin, Kresoxim-methyl, Kupfer-Zubereitungen, wie: Kupferhydroxid, Kupfernaphthenat, Kupferoxychlorid, Kupfersulfat, Kupferoxid, Oxin-Kupfer und Bordeaux-Mischung,

Mancopper, Mancozeb, Maneb, Meferimzone, Mepanipyrim, Mepronil, Metalaxyl, Metconazol, Methasulfocarb, Methfuroxam, Metiram, Metomeclam, Metsulfovax, Mildiomycin, Myclobutanil, Myclozolin,

55

Nickel-dimethyldithiocarbamat, Nitrothal-isopropyl, Nuarimol,

Ofurace, Oxadixyl, Oxamocarb, Oxolinicacid, Oxycarboxim, Oxyfenthiin,

Paclobutrazol, Pefurazoat, Penconazol, Pencycuron, Phosdiphen, Pimaricin, Piperalin, Polyoxin, Polyoxorim, Probenazol, Prochloraz, Procymidon, Propamocarb, Propanosine-Natrium, Propiconazol, Propineb, Pyrazophos, Pyrifenox, Pyrimethanil, Pyroquilon, Pyroxyfur,

Quinconazol, Quintozen(PCNB), Schwefel und Schwefel-Zubereitungen,

Tebuconazol, Tecloftalam, Tecnazen, Tetcyclacis, Tetraconazol, Thiabendazol, Thicyofen, Thifluzamide, Thiophanate-methyl, Thiram, Tioxymid, Tolclofosmethyl, Tolylfluanid, Triadimenol, Triadimenol, Triazbutil, Triazo-xid, Trichlamid, Tricyclazol, Tridemorph, Triflumizol, Triforin, Triticonazol,

Uniconazol, Validamycin A, Vinclozolin, Viniconazol,

Zarilamid, Zineb, Ziram sowie

```
Dagger G,
     OK-8705,
     OK-8801.
     2',6'-Dibrom-2-methyl-4'-trifluormethoxy-4'-trifluor-methyl-1,3-thiazol-5-carboxanilid,
    2,6-Dichlor-N-(4-trifluormethylbenzyl)-benzamid,
     2-Aminobutan
     2-Phenylphenol(OPP)
     8-Hydroxychinolinsulfat,
cis-1-(4-Chlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-cycloheptanol,

(5RS,6RS)-6-Hydroxy-2,2,7,7-tetramethyl-5-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-3-octanon,
     α-(2,4-Dichlorphenyl)-β-methoxy-α-methyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
     α-(1,1-Dimethylethyl)-β-(2-phenoxyethyl)-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
     1-[1-[2-[(2,4-Dichlorphenyl)methoxy]phenyl]ethenyl]-1H-imidazol,
    bis-(1-Methylethyl)-3-methyl-4-[(3-methylbenzoyl)oxy]-2,5-thiophendicarboxylat, 2,6-Dichlor-N-[[4-(trifluormethyl)phenyl]methyl]-benzamid,
     (E)-a-(Methoxyimino)-N-methyl-2-phenoxy-phenylacetamid,
     9H-Xanthen-9-carbonsaure-2-[(phenylamino)-carbonyl]-hydrazid,
     O-Methyl-S-phenyl-phenylpropylphosphoramidothioat,
     N-(5-Chlor-2-methylphenyl)-2-methoxy-N-(2-oxo-3-oxazolidinyl)-acetamid,
    1-(2,4-Dichlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)ethanon-O-(phenylmethyl)-oxim,
     N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-thienyl)-acetamid,
     cis-4-[3-[4-(1,1-Dimethylpropyl)-phenyl-2-methylpropyl]-2,6-dimethyl-morpholinhydrochlorid, 1-(3,5-Dichlorphenyl)-3-(2-propenyl)-2,5-pyrrolidindion,
     1-Methyl-5-nonyl-2-(phenylmethyl)-3-pyrrolidinol,
    1-[[2-(4-Chlorphenyl)-3-phenyloxiranyl]-methyl]-1H-1,2,4-triazol,
     Methantetrathiol, -Natriumsalz,
     2-(2,3,3-Triiod-2-propenyl)-2H-tetrazol,
    N-[3-Chlor-4,5-bis(2-propinyloxy)-phenyl]-N'-methoxy-methanimidamid, α-(5-Methyl-1,3-dioxan-5-yl)-β[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methylen]-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol, 1-(2-Methyl-1-naphthalenyl)-1H-pyrrol-2,5-dion,
     N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-furanyl)-acetamid,
     3,4-Dichlor-1-[4-(difluormethoxy)-phenyl]-1H-pyrrol-2,5-dion, N-[2,2,2-Trichlor-1-[(chloracetyl)-amino]-ethyl]-benzamid,
     N-Formyl-N-hydroxy-DL-alanin, -Natriumsalz,
    N-(4-Cyclohexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,
4-Methyl-tetrazolo[1,5-a]quinazolin-5(4H)-on,
     2-Chlor-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(isothiocyanatomethyl)-acetamid,
     Ethyi-[(4-chlorphenyi)-azo]-cyanoacetat,
     N-(4-Hexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,
    N-(2-Chlor-4-nitrophenyl)-4-methyl-3-nitro-benzolsulfonamid,
Methyl-N-(chloracetyl)-N-(2,6-dimethylphenyl)-DL-alaninat,
     3-[2-(4-Chlorphenyl)-5-ethoxy-3-isoxazolidinyl]-pyridin,
     2-[(1-Methylethyl)sulfonyl]-5-(trichlormethyl)-1,3,4-thiadiazol,
     spiro[2H]-1-Benzopyran-2,1'(3'H)-isobenzofuran]-3'-on,
    Methyl-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(5-isoxazolylcarbonyl)-DL-alaninat,
     Kaliumhydrogencarbonat,
     1-[[2-(2,4-Dichlorphenyl)-1,3-dioxolan-2-yl]-methyl]-1H-imidazol,
     1-[(Diiodmethyl)-sulfonyl]-4-methyl-benzol,
     2-Brom-2-(brommethyl)-pentandinitril,
    2-[[6-Deoxy-4-O-(4-O-methyl-β-D-glycopyranosyl]-α-D-glucopyranosyl]-amino]-4-methoxy-1H-pyrro-
    lo[2,3-d]pyrimidin-5-carbonitril,
     Methyl-1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat,
     2-Chlor-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridincarboxamid,
     O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat,
55 α-(2,4-Dichlorphenyl)-β-fluor-β-propyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
     3-(1,1-Dimethylpropyl-1-oxo-1H-inden-2-carbonitril,
    2.6-Dichlor-5-(methylthio) 4-pyrimidinyl-thiocyanat, S-Methyl-1,2,3-benzothiadiazol-7-carbothioat,
     N-(6-Methoxy)-3-pyridinyl)-cyclopropancarboxamid,
    3,5-Dichlor-N-[cyan[(1-methyl-2-propynyl)oxy]methyl]-benzamid,
     4-Chlor-2-cyan-N,N-dimethyl-5-(4-methylphenyl)-1 H-imidazol-1-sulfonamid,
     8-(1,1-Dimethylethyl)-N-ethyl-N-propyl-1,4-dioxaspiro[4.5] decan-2-methanamin,
     22-Dichlor-N-[1-(4-chlorphenyl)ethyl]-1-ethyl-3-methyl-cyclopropancarboxamid,
     N-(2,3-Dichlor-4-hydroxyphenyl)-1-methyl-cyclohexancarboxamid.
       Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Herbiziden oder mit Düngemitteln und Wachs-
     tumsregulatoren ist möglich.
```

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche, in Form ihren handelsüblichen Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Spritzpulver, Pasten,

lösliche Pulver, Stäubemittel und Granulate angewendet werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z. B. durch Gießen, Verspritzen, Versprühen, Verstreuen, Verschäumen, Bestreichen usw. Es ist ferner möglich die Wirkstoffe nach dem Ultra-Low-Volume-Verfahren auszubringen oder die Wirkstoffzubereitung oder der Wirkstoff selbst in den Boden zu injizieren. Es kann wird auch das Saatgut der Pflanzen behandelt werden.

Bei der Behandlung von Pflanzenteilen können die Wirkstoffkonzentrationen in den Anwendungsformen in einem größeren Bereich variiert werden: Sie liegen im allgemeinen zwischen 1 und 0,0001 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,5 und 0,001 Gew.-%.

Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 0,001 bis 50 g je Kilogramm Saatgut, vorzugsweise 0,01 bis 10 g benötigt.

Bei der Behandlung des Bodens sind Wirkstoffkonzentrationen von 0,00001 bis 0,1 Gew.-%, vorzugsweise von 10 0,0001 bis 0,02 Gew.-% am Wirkungsort erforderlich.

Herstellungsbeispiele

Verfahren a)

25

55

Zu einer Suspension von 4,0 g 3-Nitrophthalsäure-1-methylester-2-butylester (14 mMol) und 4,2 g Zinkstaub in einem Gemisch aus 60 ml Wasser und 25 ml Tetrahydrofuran tropft man unter Rühren bei 20°C innerhalb von ca. 20 Minuten 15 ml konzentrierte Salzsäure zu und rührt anschließend noch 2 Stunden bei 20°C nach. Durch Zugabe von Natriumhydrogencarbonat-Lösung wird der pH-Wert der Reaktionsmischung auf 5—6 eingestellt. Anschließend wird mit Ether extrahiert, die organische Phase mit Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und bei vermindertem Druck eingeengt. Der Rückstand wird mit Ether an Kieselgel chromatografiert.

Man erhält 2,9 g (82,4% der Theorie) 3-Aminophthalsäure-1-methylester-2-butylester als hellgelbes Öl mit 35 einem Brechungsindex von n = 1,5403

Herstellung des Ausgangsstoffes

4,1 g (15 mMol) 3-Nitrophthalsäure-2-butylester und 2,2 g (18 mMol) Dimethylformamiddimethylacetal werden in 40 ml Toluol gelöst und 12 Stunden unter Rückfluß gerührt. Die Reaktionslösung wird abgekühlt, zuerst mit Natriumhydrogencarbonatlösung und anschließend mit Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und bei vermindertem Druck bei 60°C eingeengt.

Man erhält 3,9 g (92% der Theorie) 3-Nitrophthalsäure-1-methylester-2-butylester als hellgelbes OL ¹H-NMR (CDClyTMS): 3,95 ppm (s, 3H).

Herstellung des Vorproduktes

Eine Lösung von 12 g 3-Nitrophthalsäureanhydrid (Org. Synth., Coll. Vol. I, 410 [1941]) (6,2 mMol) in 80 ml n-Butanol, wird unter Rühren 7 Stunden auf 100°C erhitzt. Das Lösungsmittel wird bei vermindertem Druck bei 60°C abdestilliert, der Rückstand mit Petrolether verrührt. Das Produkt wird über eine Fritte abgesaugt und im Vakuum bei 50°C getrocknet.

Man erhält 14,6 g (88,1% der Theorie) 3-Nitrophthalsäure-2-butylester als farblose Kristalle vom Schmelzpunkt 137°C.

Beispiel 2

NH₂ O

10

15

20

35

40

45

55

60

Verfahren a)

16,0 g (0,049 Mol) 3-Nitrophthalsäuredibutylester und 14,5 g Zinkstaub werden in einem Gemisch aus 220 ml Wasser und 85 ml Tetrahydrofuran gelöst. Bei 20°C läßt man langsam 54 ml konzentrierte Salzsäure zutropfen und rührt 2 Stunden bei 20°C. Die Reaktionsmischung wird mit Ether extrahiert, die organische Phase mit Wasser versetzt und mit Natriumhydrogencarbonat-Lösung auf einen pH-Wert von 6 eingestellt. Die Phasen werden getrennt, die organische Phase mit Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und bei vermindertem Druck eingeengt. Der Rückstand wird mit Cyclohexan/Essigester (3:1) an Kieselgel chromatografiert. Man erhält 10,8 g (75,1% der Theorie) 3-Aminophthalsäuredibutylester als hellgelbes Öl mit einem Brechungsindex von n m = 1,5251.

Herstellung des Ausgangsstoffes

NO₂ O

10,4 g (0,049 Mol) 3-Nitrophthalsäure und 25,0 g (0,123 Mol) Dimethylformamiddibutylacetal werden in 125 ml Toluol gelöst und 10 Stunden unter Rückfluß gerührt. Nach dem Abkühlen wird die Reaktionsmischung mit Wasser gewaschen, die organische Phase abgetrennt, über Natriumsulfat getrocknet und bei vermindertem Druck eingeengt. Man erhält 15,1 g (95,5% der Theorie) 3-Nitrophthalsäuredibutylester als hellbraunes ÖL ¹H-NMR [CDCL/TMS]: 4,35 ppm (t, 2H), 4,43 ppm (t, 2H).

Beispiel 3

Verfahren a)

39,0 g (0,174 Mol) 3-Nitrophthalsäure-2-methylamid und 5 g Raney-Nickel werden in 200 ml Methanol vorgelegt. Bei 50°C wird Wasserstoff mit 40-50 bar über einen Zeitraum von 4 Stunden aufgedrückt. Nach dem Abkühlen wird die Reaktionsmischung filtriert und das Filtrat bei vermindertem Druck eingeengt. Der Rückstand wird in Tetrahydrofuran aufgenommen, mit etherischer Salzsäure im Überschuß versetzt, das kristallisie-

rende Hydrochlorid abgesaugt und bei vermindertem Druck bei 50°C getrocknet. Man erhält 25,1 g (62,6% der Theorie) 3-Aminophthalsäure-2-methylamidhydrochlorid. ¹H-NMR (D₂O/TMS): 2,60 ppm (3 H).

Zu 38,6 g (0,2 Mol) 3-Nitrophthalsäureanhydrid in 50 ml Wasser läßt man 22,0 g Methylamin (35%-ige wäßrige Lösung) bei 20°C zutropfen und rührt noch 6 Stunden bei 70°C. Der nach dem Abkühlen ausfallende Niederschlag wird abgesaugt und bei 50°C im Vakuum getrocknet.

Man erhält 39,0 g (87% der Theorie) 3-Nitrophthalsäure-2-methylamid.

¹H-NMR (DMSO/TMS): δ = 2,37 ppm.

Beispiel 4

H CO₂H so

Verfahren a)

130 g (0,58 Mol) 3-Nitrophthalsäure-1-methylester (J. Amer. Chem. Soc., (1909) 486) werden unter Zusatz von 10 g Raney-Nickel bei einer Temperatur von 40°C und einem Druck von 50 bar mit Wasserstoff katalytisch reduziert. Der Katalysator wird abfiltriert und das Filtrat bei vermindertem Druck eingeengt. Der Rückstand wird mit Ether an Kieselgel chromatografiert.

Man erhält 25,2 g (22,3% der Theorie) 3-Aminophthalsäure-1-methylester als hellgelbes Öl.

¹H-NMR: 3,85 ppm (s[3H]/CDCl₃).

Herstellung des Vorproduktes

CO₂CH₃

45.2 g (0.21 Mol) 3-Nitrophthalsäure und 27 g konzentrierte Schwefelsäure werden in 450 ml Methanol gelöst und 24 Stunden unter Rückfluß gerührt. Nach dem Abkühlen wird der Ansatz unter Rückgn in Wasser gegeben. Der ausgefallene Niederschlag wird abgesaugt und bei vermindertem Druck bei 50°C getäcknet.

Man erhält 39,0 g (82,5% der Theorie) 3-Nitrophthalsäure-1-methylester als farblose Kristalle vom Schmelzpunkt 146°C (Org. Synth., Coll. Vol. I, 408 [1941]).

65

35

45

Beispiel 5

Verfahren b)

In eine Lösung von 2,1 g (8,4 mMol) 3-Aminophthalsäure-1-methylester-2-butylester und 0,84 g (8,4 mMol) Triethylamin in 40 ml Toluol läßt man 0,66 g (8,4 mMol) Acetylchlorid, gelöst in 5 ml Toluol, eintropfen. Nach Beendigung der Zugabe läßt man 2 Stunden bei 50°C nachrühren. Zur Aufarbeitung wird auf 20°C abgekühlt, die Reaktionsmischung mit Wasser gewaschen, die organische Phase über Natriumsulfat getrocknet und bei vermindertem Druck eingeengt. Der Rückstand wird mit Ether an Kieselgel chromatografiert.

Man erhält 1,8 g (73,1% der Theorie) 3-Acetylaminophthalsäure-1-methylester-2-butylester als farbloses Öl mit einem Brechungsindex von n 3 = 1,5273.

Beispiel 6

Verfahren c)

74 g (0,329 Mol) 3-Nitrophthalsäure-2-methylester und 150 ml Isobuttersäureanhydrid werden in 500 ml Methanol gelöst und mit 8 g Palladium auf Aktivkohle (5%-ig) versetzt. Bei 20°C wird 5 Stunden lang Wasserstoff mit einem Druck von 3-5 bar aufgedrückt. Die Reaktionsmischung wird entspannt, dann filtriert und das Filtrat bei vermindertem Druck eingeengt. Der Rückstand wird aus Diisopropylether umkristallisiert. Man erhält 53,8 g (61,6% der Theorie) 3-(2-Methylpropionylamino)-phthalsäure-2-methylester, vom Schmelzpunkt 137-139°C.

Herstellung des Ausgangsstoffes

26,0 g (0,135 Mol) Nitrophthalsäureanhydrid werden in 200 ml Methanol gelöst und 8 Stunden unter Rückfluß erhitzt. Das Lösungsmittel wird bei vermindertem Druck abdestilliert und der Rückstand mit Petrolether verrührt und anschließend abgesaugt. Man erhält 28,8 g (95% der Theorie) 3-Nitrophthalsäure-2-methylester. ¹H-NMR [DMSO/TMS]: 3,85 ppm (s, 3H).

65

55

5

10

25

30

Beispiel 7

15

55

Verfahren d)

3,3 g (0,011 Mol) 3-Aminophthalsäuredibutylester, 0,74 g (0,013 Mol) Methylisocyanat und 0,3 ml Triethylamin werden in 30 ml Toluol gelöst und 8 Stunden bei 60°C gerührt. Nach dem Abkühlen wird die Reaktionsmischung mit Wasser gewaschen, die organische Phase abgetrennt, über Natriumsulfat getrocknet und bei vermindertem Druck eingeengt. Der Rückstand wird mit Ether an Kieselgel chromatografiert. Man erhält 2,3 g (59,7% der Theorie) 3-(Methylaminocarbonylamino)phthalsäuredibutylester mit einem Brechungsindex von n 6 = 1,5278.

Beispiel 8

Verfahren e)

4,6 g (0,02 Mol) 3-Aminophthalsäure-2-methylamidhydrochlorid und 4,4 g (0,044 Mol) Triethylamin werden in 50 ml Acetonitril gelöst. Bei 20°C läßt man eine Lösung von 3,5 g (0,02 Mol) 6-Chlornicotinsäurechlorid in 20 ml Acetonitril zutropfen. Es wird noch 2 Stunden bei 20°C gerührt. Die Reaktionsmischung wird mit Wasser versetzt und mit Essigsäureethylester extrahiert. Die organische Phase wird über Natriumsulfat getrocknet und bei vermindertem Druck eingeengt. Der Rückstand wird mit Essigsäureethylester an Kieselgel chromatogra- 50 fiert.

Man erhält 4,35 g (65,2% der Theorie) 3-(6-Chlornicotinoylamino)phthalsäure-2-methylamid als zähes Öl. ¹H-NMR (DMSO): 2,09 ppm (3H).

Beispiel 9

Verfahren f)

4,6 g (0,02 Mol) 3-Aminophthalsäure-2-methylamidhydrochlorid und 4,4 g (0,044 Mol) Triethylamin werden in 50 ml Acetonitril gelöst. Man läßt bei 20°C eine Lösung von 2,2 g (0,021 Mol) Isobuttersäurechlorid in 10 ml Acetonitril zutropfen und rührt noch 2 Stunden bei 20°C. Die Reaktionsmischung wird mit Wasser verrührt und mit Essigsäureethylester extrahiert. Die organische Phase wird über Natriumsulfat getrocknet und bei vermindertem Druck eingeengt.

Man erhālt 2,1 g (39% der Theorie) 3-(2-Methylpropionylamino)phthalsäure-2-methylamid als hellgelbes Öl. NMR (CDCL \sqrt{TMS}): $\delta = 1,31;1,34$ ppm

Beispiel 10

Verfahren g)

3,9 g 3-Aminophthalsäure-1-methylester (20 mMol) und 2,4 g (22 mMol) ortho-Ameisensäure-trimethylester werden in 6,2 g (60 mMol) Acetanhydrid gelöst, unter Rühren auf 140°C erwärmt und 7 Stunden bei dieser Temperatur weitergerührt. Nach dem Abkühlen wird unter kräftigem Rühren mit Wasser versetzt und der ausfallende Niederschlag über eine Nutsche abgesaugt. Das Rohprodukt wird in Chloroform gelöst, über Natriumsulfat getrocknet und bei vermindertem Druck eingeengt. Der Rückstand wird in Diisopropylether verrührt, abgesaugt und bei vermindertem Druck bei 50°C getrocknet.

Man erhält 3,1 g (65,4% der Theorie) 3-Methoxymethylidenaminophthalsäuredimethylester als farblose Kristal-

¹H-NMR: 2,19 ppm (s,[3H]/CDCb)

10

15

20

25

35

40

45

50

55

Beispiel 11

Verfahren g)

5,0 g (0,024 Mol) 3-Aminophthalsäuredimethylester (J. Amer. Chem. Soc., (1937) 2580—3), 6,7 g (0,048 Mol) 4-Chlorbenzaldehyd und 0,5 g (0,0024 Mol) Toluolsulfonsäure werden in 100 ml Toluol gelöst und 4 Stunden unter Rückfluß zum Sieden erhitzt. Zur azeotropen Entfernung von Reaktionswasser wird die Hälfte des Lösungsmittels innerhalb von weiteren 4 Stunden abdestilliert. Nach dem Abkühlen wird die Lösung mit Wasser gewaschen und über Natriumsulfat getrocknet. Das Lösungsmittel wird bei vermindertem Druck abdestilliert und der Rückstand mit Cyclohexan/Essigester (3:1) an Kieselgel chromatografiert.

Man erhält 4,4 g (55% der Theorie) 3-(4-Chlorbenzylidenamino)phthalsäuredimethylester als hellgelbe Kristalle vom Schmelzpunkt 84-85°C.

Analog den Beispielen 1-11, sowie entsprechend den allgemeinen Beschreibungen der Verfahren a) bis g)

wurden die in der nachfolgenden Tabelle 1 aufgeführten Verbindungen erhalten.

DE 196 23 744 A1

5		NMR*)	3,80 (3H), (DMSO)				3,85 (3H), (CDCl ₃)	3,86 (3H), (CDCl ₃)	1,26 (3H), 1,29 (3H), (CDCl ₃)
10		F29							
15		F (°C)		8	~85	25			
20		Herstellverfahren F (°C)	ວ	ಷ	٩	q	q	q	၁
25		R4	-0-CH3	Н0-	НО-	Н0-	Н0-	-ОН	-0-СН3
30 35		\mathbb{R}^3	но-	-0-CH3	-0-СН3	-0-СН3	-0-сн	•но-о-	но-
40		R¹	Ħ	Ħ,	Ħ,	Н-	Ŧ.	H-	-Н
45							ıyı	pyl	yl
50		\mathbb{R}^2	⁶ НЭОЭ-	Ħ	-сосн	-coPh	-CO-n-Butyl	-CO-n-Propyl	-CO-i-Propyl
55	rabelle 1	Bsp-Nr	12	13	14	15	16	17	18

DE 196 23 744 A1

NMR*)		3,90 (3H), (CDCl.)	3,91 (3H), (CDCl ₃)	1,25 (3H), (CDCl ₃)	3,90 (3H), (CDCl ₃)	3,68 (3H), (CDCl ₃)
22						
F (°C)			142			
Herstellverfahren F (°C)	v	q	Ą	٩	.	q .
	-0-CH ₃	-0-СН3	. НО-	H0-	но-	Н0-
R³	H0-	H0-	-0-CH ³	-0-CH ₃	-0-СН ₃	-0-СН3
\mathbb{R}^{1}	H-	H-	H-	Ħ		#
\mathbb{R}^2	-CO-n-Propyl	-CO-Cyclopropyl	-CO-Cyclopropyl	ە <u>ج</u>	e. F. S.	-CO-Benzyl
Bsp-Nr	19	20	21	22	23	24

DE 196 23 744 A1

	_				
5	NMR*)		3,89 (3H), (CDCl ₃)	2,46 (3H), (CDCl ₃)	3,96 (3H), (CDCI ₃)
10	11.20				
15	(2°) 4		137		
20	Herstellverfahren F (°C)	م	Ð	O	o
25	R4	НО-	НО-	HO-	H0-
30 35	R3	-0-CH ₃	-0-СН ₃	-0-CH ₃	-0-СН
40	R¹	Ħ.	푸	Н-	坪
55	\mathbb{R}^2	H ₃ C CI	O CI	HO N-N CH	o=√Z
~	Bsp-Nr	22	56	27	88

DE 196 23 744 A1

NIMR*)		3,69 (3H), (CDCl ₃)	2,62 (3H), (CDCl ₃)	1,23 (3H), (CDCl ₃)	
1128					10
P (°C)					15
Herstellverfahren F (°C)	ھ	þ	v	a	24
R	-0-СН ₃	-0-СН ₃	-0-CH ₃	-0-СН ₃	25
					30
R3	HO-	Н0-	HO-	Но-	35
R¹	H-	H-	Ħ.	坪	40
	ĊH,	yl	Ť z ř	^	45
\mathbb{R}^2		-CO-Benzyl	F. Z. F.		50
Bsp-Nr	53	30	31	32	55
					60

		r	_		1		
5	NMR*)	3,70 (3H), (CDCl ₃)		3,93 (3H), (CDCl ₃)		3,89 (3H), (CDCl ₃)	
10	$^{10}_{\rm D}$						1,5613
15	F (°C)		_		157		
20	Herstellverfahren F (°C)	q	B	Φ	Ą	0	હ
25	R4	-0-CH ₃	Н0-	-0-CH	но-	-0-CH ₃	-0-СН3
35	R³	но-	но-	Н0-	Н0-	НО-	-0-СН3
40	R¹	H•		Ħ.	Ħ	H -	•
50	R ²	O CH3	H-	5	-COPh	~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~	н-
55	Bsp-Nr	33	34	35	36	37	38

DE 196 23 744 A1

			•
3,99 (3H), (DMSO)	5,39 (1H), (CDCl ₃)	3,81 (3H), (CDC) ₃)	5
			10
			15
م	م	٩	20
НО-	-0-СН	-0-СН	25
-0-CH ₃	НО-	НО-	30 35
Ħ.	뚜	, o, s,	40
O CH ₈	H,C CI	O CCH,	45 50
39	40	41	56
	о -H -O-CH ₃ -OH b	от но-сн ₃ -он в но-сн ₃ гон в но-сн	H-0-CH ₃ -OH b H ₀ CH ₃ -OH b H ₀ CH ₃ b

DE 196 23 744 A1

		,						
5	NMR*)	3,78 (3H), (CDCl ₃)				1,21 (3H), 1,24 (3H), (CDC(3)		13,66 (2H), (DMSO)
10	200				1,5885			
15	F (°C)	·	79-80	180				221
20	Herstellverfahren F (°C)	൧	q	q	q	Ą	.	0
25	\mathbb{R}^4	Н0-	-0-СН3	Н0-	-0-CH ₃	Н0-	Но-	Н0-
30 35	R³	-О-СН ₃	-0-CH ₃	но-	-0-СН3	НО-	Н0-	НО-
40	R	Ħ.	H-	H.	H-	н-	H-	#
45		, P				yl		<u>5</u>
~	\mathbb{R}^2		-сосн	-сосн	-COPh	-CO-i-Propyl		
55	Bsp-Nr	42	43	44	45	46	41	48

DE 196 23 744 A1

	1	1	T	1	1	T	T			
NMR*)	2,68 (3H), (CDCl ₃)		2,51; (DMSO)	2,50; (DMSO)	0,99 (3H), 1,01 (3H), (DMSO)					
22						1,5334			1,5563	
F (°C)					127		86	126- 128		
Herstellverfahren F (°C)	q	O	4-1	ą.	P	æ	æŝ	ಹ	65	
	-0-СН	но-	НО-	НО-	Н0-	-O-nPr	но-	H0-	Ю-	
R³	но-	но-	-NH-CH3	Н0-	но-	-O-nPr	-O-nPr	-0-iPr	-n-Butoxy	
R	H-	Ħ.	Ħ.	H-	Ħ.	H- ,	甲	#	H- ·	
R ²	-co-NH-CH ₃	o B	-coph	-CO-NH-CH ₃	-CO-NH-i-Propyl	H-	H-	н-	H-	
Bsp-Nr	49	20	51	52	53	54	55	99	27	

			_			·					
5	NMR*)										
10	250			1,5362	1,5171						
15	F (°C)	66-76	89			93-95	19-09	88	56-58	128- 130	94-98
20	Herstellverfahren F (°C)	e 3	Ą	q	p	ਚ	q	q	þ	æ	.
25	R4	H0-	-O-nPr	-O-nPr	-n-Butoxy	-n-Butoxy	-О-СН3	H0-	Ho-	-N(CH ₃) ₃	-0-СН ₃
30 35	R³	-0-Cyclohexyl	-O-nPr	-O-nPr	-n-Butoxy	-n-Butoxy	-0-CH ₃	-n-C ₁₂ H ₂₅	-0-Cyclohexyl	-0-сн³	-0-CFg
40	R	Н-	H-	Η·	H-	H-	H-	H-	H-		.
45				Ж,	3		Is				₹
50 55		Н-	-сосн	-CO-NH-CH ₃	-сосн)=/ =0	-соос,н,	-сосн	-сосн	H-	
<i></i>	Bsp-Nr	28	59	09	61	62	63	64	65	99	67

DE 196 23 744 A1

NMR*)			5
19.20 19.20			10
F (°C)	139-	131-	15
Herstellverfahren F (°C)	©	O	20
R4	-0- СН ₃	-0-СН	25
R³	-0-СН ₃	-0-CH ₃	30 . 35
R¹	Ħ,	Ħ.	40
\mathbb{R}^2	£ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~	H ₃ C CH ₃	45
Bsp-Nr	89	69	55

5	NMR*)			
10	200			·
15	P (°C)	110-	105-	86-96
20	Herstellverfahren F (°C)	.	೮	o
25	R4	-0-СН ₃	-0-CH ₃	-0-СН
30 35	R³	-0-СН3		-0-СН3
40	R	H -	H-	坪 · · · ·
45		/= \ ⁴	,CH,	^ -
50	\mathbb{R}^2		O H ₃ C H ₃ C	H ₃ C
55	Bsp-Nr	07	71	27

NMR*)			3,85 (3H), (CDCl ₃)	3,23 (3H), (CDCl ₃)
n ₂ 20				
F (°C)	75-78	100- 102		
Herstellverfahren F (°C)	q	a	ಕಂ	8
R4	-0-СВ	-0-СН3	-0-СН3	-0-CH ₃
R³	-0-CH ₃	-0-CH ₃	-0-СН	Н0-
R¹	н-	j	13)2	
\mathbb{R}^2	O CH ₃		=CH-N(CH ₃) ₂	
Bsp-Nr	73	74	75	76

Tetramethylsilan (TMS) als innerem Standard aufgenommen. Angegeben ist die chemische Verschiebung als d-Wert in Das ¹H-NMR-Spektrum wutde in Deuterochloroform (CDCl₃) oder Hexa-deuterodimethylsulfoxid (DMSO-d₆) mit

10

15

20

25

30

35

Beispiel A

Plasmopara-Test (Reben)/protektiv

Lösungsmittel: 4,7 Gewichtsteile Aceton Emulgator: 0,3 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den

angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wäßrigen Sporensuspension von Plasmopara viticola inokuliert und verbleiben dann 1 Tag in einer Feuchtkammer bei 20 bis 22°C und 100% relativer Luftfeuchtigkeit. Anschließend werden die Pflanzen 5 Tage im Gewächshaus bei 21°C und ca. 90% Luftfeuchtigkeit aufgestellt. Die Pflanzen werden dann angefeuchtet und 1 Tag in eine Feuchtkammer gestellt.

6 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung.

Bei diesem Test zeigen z. B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele (4), (6), (13) und (15) bei einer beispielhaften Wirkstoffkonzentration von 100 ppm einen Wirkungsgrad bis zu 97% im Vergleich zur unbehandelten Kontrolle.

Beispiel B

Botrytis-Test (Bohne)/protektiv

Lösungsmittel: 4,7 Gewichtsteile Aceton Emulgator: 0,3 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

15

30

55

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewinschte Konzentration.

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden auf jedes Blatt 2 kleine mit Botrytis einerea bewachsene Agarstückenen aufgelegt. Die inokulierten Pflanzen werden in einer abgedunkelten, feuchten Kammer bei 20°C aufgestellt. 3 Tage nach der Inokulation wird die Größe der Befallsflecken auf den Blättern ausgewertet.

Bei diesem Test zeigen z. B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele (4), (6), (13), (14), (15), (16) und (17) bei einer beispielhaften Wirkstoffkonzentration von 100 ppm einen Wirkungsgrad bis zu 98%.

Beispiel C

Pseudocercosporella herpotrichoides-Test (Weizen)/protektiv

Lösungsmittel: 10 Gewichtsteile N-Methyl-pyrrolidon Emulgator: 0,6 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit besprüht man junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge.

Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen an der Halmbasis mit Sporen von Pseudocercosporella herpotrichoides inokuliert.

Die Pflanzen werden in einem Gewächshaus bei einer Temperatur von ca. 10°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 80% aufgestellt.

21 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung.

Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen (4) und (14) der Herstellungsbeispiele bei einer beispielhaften Wirkstoffkonzentration in der Spritzbrühe von 250 ppm Wirkungsgrad von 100% im Vergleich zur unbehandelten Kontrolle.

Anhang: Verfahren:

a)
$$NO_2$$
 R^{17} R^{18} R^{18} R^{18} R^{18} R^{18}

R23 und R24 = nur Alkoxy oder nicht gleichzeitig Hydroxy c)
$$R^{21} = COR25$$
 $R^{23} + R^{25} = COR25$
(III) (III) (Ib) 45

R23 und R24 = nur Alloxy oder nicht gleichzeitig Hydroxy

d)
$$R26-N=C=0 \text{ (Vill)}$$

$$R^{25} \qquad R^{25} \qquad R^{25} \qquad R^{25} \qquad R^{25} \qquad R^{25} \qquad R^{25} \qquad R^{25}$$

$$R^{25} \qquad R^{25} \qquad R^{25} \qquad R^{25} \qquad R^{25} \qquad R^{25}$$

$$R^{25} \qquad R^{25} \qquad R^$$

R30 = Heterocyclyl R31 = OH oder NR2

196 23 744 A1

f) (XIII)

R34 = Kohlenwasserstoffe

g)

R39/40 = R3/4

10

15

20

25

30

35

55

65

Patentansprüche

1. Verwendung von Verbindungen der Formel (I),

45 **(I)** 50 \ddot{Q}^2

in welcher Q^1 und Q^2 gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Sauerstoff oder Schwefel stehen, R^1 für Wasserstoff oder die Gruppierung

worin R¹¹ die unten angegebene Bedeutung hat, R² für Wasserstoff oder eine der nachfolgenden Gruppierungen

steht,

wori

5

10

15

20

25

35

40

45

50

55

60

65

R⁸ für Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl, jeweils gegebenenfalls substituiertes Aryl oder Heteroaryl steht, R⁹ für Wasserstoff oder Alkyl steht, oder

 R^a und R^a gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl stehen,

R¹⁰ für gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Aryl oder Cycloalkyl substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl oder für Heterocyclyl steht,

R¹¹ für Wasserstoff oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Aryl, Arylalkyl oder Heterocyclyl steht,

R¹² für Alkyl, Aryl oder Heterocyclyl steht, oder R¹ und R² gemeinsam für eine Gruppierung

stehen, worin

R¹³ für Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl oder gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl steht und

R¹⁴ für Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Cycloalkenyl, Aryl, Heterocyclyl, Alkoxy oder Dialkylamino

R¹³ und R¹⁴ gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für Cycloalkyliden stehen, oder R¹ und R² gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl stehen,

R³ und R⁴ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, ArylaIkoxy, CycloaIkoxy, CycloaIkoxy, Aryloxy, Heterocyclyloxy, Mercapto, Alkylthio, Alkenylthio, Alkinylthio, ArylaIkylthio, CycloaIkylthio, CycloaIkenylthio, Arylthio, Heterocyclylthio oder

stehen, wobei

R¹⁵ für Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl, jeweils gegebenenfalls substituiertes Aryl oder Heteroaryl steht,

R¹⁶ für Wasserstoff oder Alkyl steht, oder

R¹⁵ und R¹⁶ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl stehen und

R⁵, R⁶ und R⁷ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Halogenalkyl, Halogenalkoxy oder Halogenalkylthio stehen,

zur Bekämpfung von Schädlingen.

2. Verwendung der Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher

 Q^1 und Q^2 gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Sauerstoff oder Schwefel stehen, R^1 für Wasserstoff oder die Gruppierung



steht, worin R^{11} die unten angegebene bevorzugte Bedeutung hat, steht, R^2 für Wasserstoff oder eine der nachfolgenden Gruppierungen

steht, worin

R⁸ für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, jeweils 1 gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Halogen, Alkyl, Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1-5 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocycyl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht, R⁹ für Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, oder

5

R⁸ und R⁹ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes 15 Heterocyclyl mit 3 bis 7 Ringgliedern stehen,

R¹⁰ für gegebenenfalls durch Phenyl oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen substituiertes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkinyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen oder für Heterocyclyl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht,

R¹¹ für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls durch Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyl oder Carboxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 5 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 2 bis 5 Kohlenstoffatomen, Alkinyl mit 2 bis 5 Kohlenstoffatomen oder jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen oder Halogen substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Aryl, Arylalkyl oder Heterocyclyl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht,

R¹² für Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Phenyl, Naphthyl oder Heterocyclyl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht, oder

R¹ und R² gemeinsam für eine Gruppierung

$$= R^{14}$$

$$= R^{13}$$
30

stehen, worin

R¹³ für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Alkyl, Alkoxy, Halogen, Cyano oder Nitro substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocyclyl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht und

R¹⁴ für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Phenyl, Naphthyl, Heterocyclyl mit 3 bis 7 Ringgliedern, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylteilen steht oder

R¹³ und R¹⁴ gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für Cycloalkyliden mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen stehen, oder

 R^1 und R^2 gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl mit 3 bis 7 Ringgliedern stehen,

R³ und R⁴ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy mit 1 bis 12 Kohlenstoffatomen, Alkenyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen, Alkinyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen, Phenylalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Cycloalkoxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyloxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Phenoxy, Heterocyclyloxy mit 3 bis 7 Ringgliedern, Mercapto, Alkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkenylthio mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkylthio mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Arylalkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Cycloalkylthio mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenylthio mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Phenylthio, Heterocyclylthio mit 3 bis 7 Ringgliedern oder

stehen, wobei

R¹⁵ für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Halogen, Alkyl, Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen,

DE 196 23 744

Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1-5 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocycyl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht, R¹⁶ für Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, oder

R15 und R16 gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiertes Heterocyclyl mit 3 bis 7 Ringgliedern stehen, und

R5, R6 und R7 gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl, Halogenalkoxy oder Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen stehen.

3. Verwendung der Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher

Q1 und Q2 gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Sauerstoff oder Schwefel stehen, R¹ für Wasserstoff oder die Gruppierung



5

10

15

20

25

30

35

40

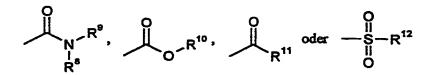
45

50

55

65

worin R11 die unten angegebene, besonders bevorzugte Bedeutung hat, steht, R² für Wasserstoff oder eine der nachfolgenden Gruppierungen



R8 für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl oder jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Difluormethoxy oder Difluorchlormethoxy, substituiertes Phenyl, Naphthyl, Thienyl, Pyridyl oder Furyl steht,

R9 für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl steht, oder

R⁸ und R⁹ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl substituiertes Pyrrolyl, Piperidyl, Morpholinyl oder Piperazinyl stehen,

R10 für Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Benzyl, 1-Phenylethyl, 2-Phenylethyl, Cyclohex-

ylmethyl, Allyl, Propargyl, Oxethan-3-yl steht,

R11 für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls durch Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Acetyl oder Carboxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Vinyl, Allyl, Propargyl, Penta-1,3-dien-1-yl oder jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Phenyl, Benzyl, Thienyl, Furyl, Pyrazolyl, Pyridyl oder 2,3-Dihydro[1,4]oxathiin steht,

R¹² für Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Phenyl, Naphthyl, Thienyl, Furyl oder Pyridyl

steht, oder

R1 und R2 gemeinsam für eine Gruppierung

$$=$$
 R^{14}

R13 für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Vinyl, Allyl, Propargyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclopentenyl, Cyclopentenyl, Cyclohexenyl, Phenyl, Methylphenyl, Fluorphenyl, Chlorphenyl, Bromphenyl, Cyanphenyl, Methoxyphenyl, Nitrophenyl, Thienyl, Fyridyl oder Chlorpyridyl steht und

Rid für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Allyl, Propargyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Phenyl, Thienyl, Furyl oder Pyridyl, Methoxy, Ethoxy, Dimethylamino,

Diethylamino steht oder

R13 und R14 gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für Cyclopropyliden, Cyclobutyliden, Cyclopentyliden oder Cyclohexyliden stehen, oder

R¹ und R² gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl substituiertes Pyrrolyl, Piperidyl, Morpholinyl, Piperazinyl oder Succinimidyl stehen, R³ und R⁴ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Pentoxy, Hexyloxy, Heptyloxy, Octyloxy, Nonyloxy, Decyloxy, Undecyloxy, Dodecyloxy, Allyloxy, Propargyloxy, Benzyloxy, Cyclopentyloxy, Cyclohexyloxy, Cyclohexenyloxy, Phenoxy, Oxetan-3-yloxy, Mercapto, Methylthio, Ethylthio, Allylthio, Propargylthio, Benzylthio, Cyclopentylthio, Cyclohexenylthio, Phenylthio, Amino, Methylamino, Ethylamino, Dimethylamino, Phenylamino oder über ein Stickstoffatom gebundenes, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl substituiertes Pyrrolyl, Piperidyl, Morpholinyl oder Piperazinyl stehen und

R⁵, R⁵ und R⁷ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, 10 Iod, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethylthio, Difluormethylthio, Difluormethylthio, Difluormethylthio, Difluormethylthio, Difluormethylthio, Difluormethylthio

4. Verbindungen der Formel (Ia),

25

45

50

R¹⁷ und R¹⁸ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Arylakoxy, Cycloalkoxy, Cycloalkoxy, Aryloxy, Heterocyclyloxy oder

stehen, wobei

 R^{19} für Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl, jeweils gegebenenfalls substituiertes Aryl oder Heteroaryl steht, R^{20} für Wasserstoff oder Alkyl steht, oder

 R^{19} und R^{20} gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes 40 Heterocyclyl stehen,

wobei die Verbindungen

Aminophthalsäuredimethylester,

3-Aminophthalsaurediethylester,

3-Aminophthalsäuredi-n-propylester,

3-Aminophthalsaure-1-methylester,

3-Aminophthalsäure-2-methylester,

3-Aminophthalsäure,

3-Aminophthalamid,

2-(N-Methyl-N-phenyl-carbamoyl)-6-amino-benzanilid,

1,2-Bis-(N-methyl-N-phenyl-carbamoyl)-3-amino-benzol und

2-(N-Methyl-N-phenyl-carbamoyl)-3-carbomethoxy-anilin,

ausgenommen sind.

5. Verbindungen der Formel (I-a) gemäß Anspruch 4, in welcher

R¹⁷ und R¹⁸ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy mit 1 bis 12 Kohlenstoffatomen, Alkenyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen, Alkinyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen, Phenylalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Cycloalkoxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyloxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Phenoxy, Heterocyclyloxy mit 3 bis 7 Ringgliedern, oder

stehen, wobei

R¹⁹ für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, jeweils

gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Halogen, Alkyl, Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1-5 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocycyl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht, R²⁰ für Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, oder

- R¹⁹ und R²⁰ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiertes Heterocyclyl mit 3 bis 7 Ringgliedern stehen
- 6. Verbindungen der Formel (I-a) gemäß Anspruch 4, in welcher
 R¹⁷ und R¹⁸ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Methoxy, Ethoxy, noder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Pentoxy, Hexyloxy, Heptyloxy, Octyloxy, Nonyloxy, Decyloxy, Undecyloxy, Dodecyloxy, Allyloxy, Propargyloxy, Benzyloxy, Cyclopentyloxy, Cyclohexyloxy, Cyclohexenyloxy, Phenoxy, Oxetan-3-yloxy, Amino, Methylamino, Ethylamino, Dimethylamino, Phenylamino oder über ein Stickstoffatom gebundenes, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl substituiertes Pyrrolyl, Piperidyl, Morpholinyl oder Piperazinyl stehen.
- 7. Verbindungen der Formel (I-b),

$$R^{21}$$
 R^{22} R^{23} R^{24} (I-b)

in welcher
R²¹ für Wasserstoff oder die Gruppierung

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

65

steht, worin R^{25} die unten angegebene Bedeutung hat, R^{22} für die Gruppierung

steht, worin

R²⁵ für Wasserstoff oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Aryl, Arylalkyl oder Heterocyclyl steht,

- R²³ und R²⁴ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Arylalkoxy, Cycloalkoxy, Cycloalkenyloxy, Aryloxy, Heterocyclyloxy stehen, wobei R²³ und R²⁴ nicht gleichzeitig für Hydroxy stehen und die Verbindungen
 - 3-Acetylamino-phthalsäuredimethylester und
 - 3-Acetylamino-phthalsäure-1-methylester ausgenommen sind.
 - 8. Verbindungen der Formel (I-b) gemäß Anspruch 7, in welcher
 - R²¹ für Wasserstoff oder die Gruppierung

steht, worin R²⁵ die unten angegebene bevorzugte Bedeutung hat, R²² für die Gruppierung

steht, worin

R²⁵ für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls durch Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyl oder Carboxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 5 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 2 bis 5 Kohlenstoffatomen, Alkinyl mit 2 bis 5 Kohlenstoffatomen oder jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen oder Halogen substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Aryl, Arylalkyl oder Heterocyclyl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht,

5

20

30

R²³ und R²⁴ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy mit 1 bis 12 Kohlenstoffatomen, Alkenyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen, Alkinyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen, Phenylalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Cycloalkoxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyloxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Phenoxy, Heterocyclyloxy mit 3 bis 7 Ringgliedern stehen, wobei R²³ und R²⁴ nicht gleichzeitig für Hydroxy stehen.

9. Verbindungen der Formel (1-b) gemäß Anspruch 7, in welcher

R²¹ für Wasserstoff oder die Grundierung

steht.

worin \mathbb{R}^{25} die unten angegebene besonders bevorzugte Bedeutung hat, \mathbb{R}^{22} für die Gruppierung

steht worin

R²⁵ für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls durch Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Acetyl oder Carboxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Vinyl, Allyl, Propargyl, Penta-1,3-dien-1-yl oder jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Phenyl, Benzyl, Thienyl, Furyl, Pyrazolyl, Pyridyl oder 2,3-Dihydro[1,4]oxathiin steht,

R²³ und R²⁴ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Methoxy, Ethoxy, noder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Pentoxy, Hexyloxy, Heptyloxy, Octyloxy, Nonyloxy, Decyloxy, 45 Undecyloxy, Dodecyloxy, Allyloxy, Propargyloxy, Benzyloxy, Cyclopentyloxy, Cyclohexyloxy, Cyclohexenyloxy, Phenoxy oder Oxetan-3-yloxy stehen, wobei R²⁵ und R²⁴ nicht gleichzeitig für Hydroxy stehen.

10. Verbindungen der Formel (I-c),

in welcher

 R^{26} für Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl, jeweils gegebenenfalls substituiertes Aryl oder Heteroaryl steht, R^{27} für Wasserstoff oder Alkyl steht, oder

R²⁶ und R²⁷ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl stehen und R²⁶ und R²⁶ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy, Alkenyloxy,

DE 196 23 744

Alkinyloxy, Arylalkoxy, Cycloalkoxy, Cycloalkenyloxy, Aryloxy, Heterocyclyloxy stehen.

11. Verbindungen der Formel (I-c) gemäß Anspruch 10, in welcher

R26 für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Halogen, Alkyl, Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1-5 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocycyl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht, R²⁷ für Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, oder

R²⁶ und R²⁷ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl mit 3 bis 7 Ringgliedern stehen und

R²⁸ und R²⁹ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy mit 1 bis 12 10 Kohlenstoffatomen, Alkenyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen, Alkinyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen, Phenylalkoxy mit 1 bis 12 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Cycloalkoxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyloxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Phenoxy oder Heterocyclyloxy mit 3 bis 7 Ringgliedern

12. Verbindungen der Formel (I-c) gemäß Anspruch 10, in welcher R²⁶ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopen-

tyl, Cyclohexyl oder jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Difluormethoxy oder Difluorchlormethoxy, substituier-

tes Phenyl, Naphthyl, Thienyl, Pyridyl oder Furyl steht,

R²⁷ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl steht, oder

R²⁶ und R²⁷ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl substituiertes Pyrrolyl, Piperidyl, Morpholinyl oder Piperazinyl stehen und

R²⁸ und R²⁹ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Methoxy, Ethoxy, noder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Pentoxy, Hexyloxy, Heptyloxy, Octyloxy, Nonyloxy, Decyloxy, Undecyloxy, Dodecyloxy, Allyloxy, Propargyloxy, Benzyloxy, Cyclopentyloxy, Cyclohexyloxy, Cyclohexenyloxy, Phenoxy oder Oxetan-3-yloxy stehen.

13. Verbindungen der Formel (I-d),

in welcher

R30 für gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl steht und

R31 für Hydroxy oder

R³² für Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl, jeweils gegebenenfalls substituiertes Aryl oder Heteroaryl steht,

R33 für Wasserstoff oder Alkyl steht, oder

 \mathbb{R}^{32} und \mathbb{R}^{33} gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl stehen.

14. Verbindungen der Formel (I-d) gemäß Anspruch 13, in welcher

R³⁰ für gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen oder Halogen substituiertes Heterocyclyl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht und

R³¹ für Hydroxy oder

65

5

15

20

25

35

40

45

50

55

steht, wobe

R³² für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Halogen, Alkyl, Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1—5 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocycyl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht, R³³ für Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, oder

5

R³² und R³³ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiertes Heterocyclyl mit 3 bis 7 Ringgliedern 15 stehen.

15. Verbindungen der Formel (I-d) gemäß Anspruch 13, in welcher

R³⁰ für für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl, Ethyl, Triffuormethyl, Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Thienyl, Furyl, Pyrazolyl, Pyridyl oder 2,3-Dihydro[1,4]oxathiin steht und

R³¹ für Hydroxy, Amino, Methylamino, Ethylamino, Dimethylamino, Phenylamino oder über ein Stickstoffatom gebundenes, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl substituiertes Pyrrolyl, Piperidyl, Morpholinyl oder Piperazinyl steht.

16. Verbindungen der Formel (I-e),

in welcher

R34 für Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl oder Aryl steht,

 $m R^{35}$ für Wasserstoff oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, Aryl oder Heteroaryl steht, 40 $m R^{36}$ für Wasserstoff oder Alkyl steht, oder

R³⁵ und R³⁶ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes Heterocychyl stehen.

17. Verbindungen der Formel (I-e) gemäß Anspruch 16, in welcher

R³⁴ für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls durch Alkoxycarbonyl substituiertes Alkyl mit 1 bis 5 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 2 bis 5 Kohlenstoffatomen, Alkinyl mit 2 bis 5 Kohlenstoffatomen oder jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen oder Halogen substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Aryl oder Arylalkyl steht,

R³⁵ für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, jeweils 50 gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Halogen, Alkyl, Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1—5 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocycyl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht, R³⁶ für Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, oder

R³⁵ und R³⁶ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls einfach bis 55 dreifach durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiertes Heterocyclyl mit 3 bis 7 Ringgliedern stehen.

18. Verbindungen der Formel (I-e) gemäß Anspruch 16, in welcher

R34 für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls durch Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Vinyl, Allyl, Propargyl, Penta-1,3-dien-1-yl oder jeweils 60 gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Phenyl oder Benzyl steht, R35 für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Phenyl, Cyclopropyl oder Oxethan-3-yl steht,

R36 für Wasserstoff oder Methyl steht, oder

R35 und R36 gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für jeweils gegebenenfalls einfach 65 bis dreifach durch Methyl substituiertes Pyrrolyl, Piperidyl, Morpholinyl oder Piperazinyl stehen.
19. Verbindungen der Formel (I-f),

in welcher

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

65

R³⁷ für Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl oder gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl steht und

R³⁸ für Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Aryl, Heterocyclyl, Alkoxy oder Dialkylamino steht oder

R³⁷ und R³⁸ gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für Cycloalkyliden stehen, und R³⁹ und R⁴⁰ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Arylalkoxy, Cycloalkoxy, Cycloalkenyloxy, Aryloxy, Heterocyclyloxy, Mercapto, Alkylthio, Alkenylthio, Alkinylthio, Arylalkylthio, Cycloalkylthio, Cycloalkenylthio, Arylthio, Heterocyclylthio oder

stehen, wobei

 R^{41} für Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl, jeweils gegebenenfalls substituiertes Aryl oder Heteroaryl steht, R^{42} für Wasserstoff oder Alkyl steht, oder

 \mathbb{R}^{41} und \mathbb{R}^{42} gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl stehen.

20. Verbindungen der Formel (I-f) gemäß Anspruch 19, in welcher

R³⁷ für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Alkyl, Alkoxy, Halogen, Cyano oder Nitro substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocyclyl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht und

R³⁸ für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Phenyl, Heterocyclyl mit 3 bis 7 Ringgliedern, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylketten steht oder

R³⁷ und R³⁸ gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für Cycloalkyliden mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen stehen, und

R³⁹ und R⁴⁰ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Alkoxy mit 1 bis 12 Kohlenstoffatomen, Alkenyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen, Alkinyloxy mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen, Phenylalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Cycloalkoxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenyloxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Phenoxy, Heterocyclyloxy mit 3 bis 7 Ringgliedern, Mercapto, Alkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkenylthio mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Arylalkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Cycloalkylthio mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenylthio mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, Phenylthio, Heterocyclylthio mit 3 bis 7 Ringgliedern oder

stehen, wobei

R⁴¹ für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Halogen, Alkyl, Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1—5 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocycyl mit 3 bis 7 Ringgliedern steht, R⁴² für Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, oder

dreifach durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiertes Heterocyclyl mit 3 bis 7 Ringglied stehen.		
21. Verbindungen der Formel (I-f) gemäß Anspruch 19, in welcher R ³⁷ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Vinyl, Allyl, Propargyl, Cycloprocyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclopentenyl, Cyclohexenyl, Phenyl, Methylphenyl, Fluorphenyl, Chlorphenyl, Bromphenyl, Cyanphenyl, Methoxyphenyl, Nitrophenyl, Thienyl, Furyl, Pyridyl oder Chlorridyl steht und	nyl,	5
R ³⁸ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, s-, i- oder t-Butyl, Vinyl, Cyclopropyl, Cyclobu Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopentenyl, Cyclohexenyl, Phenyl, Thienyl oder Pyridyl, Methoxy, Etho Dimethylamino oder Diethylamino steht oder R ³⁷ und R ³⁸ gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für Cyclopentyliden oc Cyclohexyliden stehen, und	xy,	10
R ³⁹ und R ⁴⁰ gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander für Hydroxy, Methoxy, Ethoxy, oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Pentoxy, Hexyloxy, Heptyloxy, Octyloxy, Nonyloxy, Decylo Undecyloxy, Dodecyloxy, Allyloxy, Propargyloxy, Benzyloxy, Cyclopentyloxy, Cyclohexyloxy, Cyclohexyloxy, Phenoxy, Oxetan-3-yloxy, Mercapto, Methylthio, Ethylthio, Allylthio, Propargylthio, Benzylthio, (xy, en- Cy-	15
clopentylthio, Cyclohexylthio, Cyclohexenylthio, Phenylthio, Amino, Methylamino, Ethylamino, Dimethymino, Phenylamino oder über ein Stickstoffatom gebundenes, jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifs durch Methyl substituiertes Pyrrolyl, Piperidyl, Morpholinyl oder Piperazinyl stehen. 22. Schädlingsbekämpfungsmittel, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einer Verbindung of Formel (I) nach Anspruch 1.	ich ler	20
 Verfahren zur Bekämpfung von Schädlingen, dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen of Formel (I) nach Anspruch 1 auf Schädlinge und/oder ihren Lebensraum einwirken läßt. Verfahren zur Herstellung von Schädlingsbekämpfungsmitteln, dadurch gekennzeichnet, daß man Vebindungen der Formel (I) nach den Ansprüchen 1 bis 21 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiv Mitteln vermischt. 	er-	25
		30